

, m), 4.49 (2H, s), 4.84 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.43 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.52 (1H, s), 8.22 (1H, t, J=4.8Hz), 8.50 (1H, s), 9.19 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 607.4 (MH⁺)

実施例 677

- 5 1-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.27 (6H, t, J=7Hz), 1.39 (9H, s), 2.29-2.35 (1H, m), 2.54-2.75 (2H, m), 2.95 (1H, dd, J=12, 9Hz), 3.20 (3H, d, J=5Hz), 4.15-4.28 (3H, m), 4.35 (2H, q, J=7Hz), 4.54 (1H, d, J=19Hz), 5.30 (1H, d, J=11Hz), 5.40 (1H, d, J=19Hz), 5.33 (1H, d, J=11Hz), 7.17 (1H, s), 7.20 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=2Hz), 8.17 (1H, q, J=5Hz), 8.38 (1H, s), 8.78 (1H, d, J=2Hz), 9.45 (1H, brs), 10.02 (1H, br. 2), 10.08 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 579.0 (MH⁺)

- 15 実施例 678

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.28 (3H, t, J=7Hz), 1.41 (3H, t, J=7Hz), 1.42 (9H, s), 1.54 (3H, t, J=7Hz), 2.24-2.31 (1H, m), 2.58 (1H, ddd, J=14, 8, 3Hz), 2.66 (td, J=14, 5Hz), 2.93 (1H, ddd, J=14, 11, 8Hz), 4.16-4.28 (7H, m), 4.70 (1H, d, J=19Hz), 5.05 (1H, d, J=19Hz), 5.17 (1H, d, J=19Hz), 5.32 (1H, d, J=19Hz), 6.88 (1H, s), 7.93 (1H, d, J=2Hz), 8.35 (1H, d, J=2Hz), 8.83 (1H, s).

- 25 MS:m/e (ESI) 584.0 (MH⁺)

実施例 679

1-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.18 (3H, t, J=7Hz), 1.42 (9H, s) 1.60 (3H, t, J=7Hz), 2.32-2.36 (1H, m) 2.54-2.67 (2H, m), 2.77-2.84 (1H, m), 3.16 (3H, d, J=5Hz), 3.80 (3H, s), 4.11-4.22 (2H, m), 4.36 (2H, q, J=7Hz), 4.74 (1H, d, J=19Hz), 4.75 (1H, m), 4.93 (1H, d, J=19Hz), 5.69 (1H, d, J=18Hz), 6.56 (1H, d, J=18Hz), 7.21 (1H, s), 7.25 (1H, s), 8.05 (1H, d, J=2Hz), 8.13 (1H, d, J=2Hz), 8.19 (1H, q, J=5Hz), 9.48 (1H, s).

10 MS:m/e (ESI) 593.0 (MH⁺)

実施例 680

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.18 (3H, t, J=7Hz), 1.42 (3H, t, J=7Hz), 1.43 (9H, s), 1.54 (3H, t, J=7Hz), 2.31-2.36 (1H, m), 2.54-2.65 (2H, m), 2.76-2.84 (1H, m), 3.81 (3H, s), 4.15-4.23 (6H, m), 4.65 (1H, d, J=18Hz), 4.74 (1H, dt, J=2, 6Hz), 4.86 (1H, d, J=18Hz), 5.61 (1H, d, J=19Hz), 6.87 (1H, s), 6.98 (1H, brs), 8.03 (1H, d, J=2Hz), 8.11 (1H, d, J=2Hz).

20 MS:m/e (ESI) 593.0 (MH⁺)

実施例 681

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-7-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 1.44 (18H, s), 2.86 (3H, d, J=4.4Hz), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.8

3 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.77 (2H, s), 7.81 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.72 (1H, m).

実施例 682

2-[2-(5-第 3 ブチル-2-オキシ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-7-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン

5 酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.43 (12H, m), 2.45 (2H, t, J=7.2Hz), 2.84 (3H, d, J=4.8Hz), 3.18 (2H, t, J=7.2Hz), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.87 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.41 (1H, d, J=1.6Hz), 7.56 (1H, s), 7.61 (1H, d, J=1.6Hz), 8.23 (1H, q, J=4.8Hz), 8.58 (1H, s), 9.22 (1H, s), 9.86 (1H, s), 10.33 (1H, s).

10

実施例 683

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;トリフルオロ酢酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 1.93-2.04 (2H, m), 2.28 (2H, t, J=7.2Hz), 4.05 (2H, t, J=6.8Hz), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.45 (2H, s), 6.83 (1H, brs), 7.33 (1H, brs), 7.44 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.70 (1H, brs), 7.78 (1H, brs), 8.63 (1H, s), 9.18 (1H, brs), 9.46 (1H, s), 9.82 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 511.3 (MH⁺)

実施例 684

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 ジメチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29-1.46 (12H, m), 1.93-2.06 (2H, m), 2.23-2.33 (2H, m), 2.78 (3H, s), 2.99 (3H, s), 4

. 01-4. 12 (2H, m), 4. 17-4. 28 (2H, m), 4. 83 (3H, s), 5. 45 (3H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 33 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 03 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 46 (1H, brs), 9. 67 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 539. 4 (MH⁺)

5 実施例 685

2-[2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 39 (9H, s), 1. 93-2. 04 (2H, m), 2. 23-2. 33 (2H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 93 (6H, s), 4. 01-4. 09 (2H, m), 4. 73 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 43 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 06 (1H, s), 8. 34-8. 39 (1H, m), 8. 86 (1H, brs), 9. 44 (1H, brs), 9. 52 (1H, brs).

実施例 686

15 4-[3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ]-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 28 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 34-1. 46 (12H, m), 1. 94-2. 04 (2H, m), 2. 24-2. 32 (2H, m), 4. 00-4. 08 (2H, m), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 6. 82 (1H, brs), 7. 28-7. 36 (2H, m), 7. 42 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 00-9. 08 (1H, m), 9. 32 (1H, brs), 9. 46 (1H, s).

実施例 687

25 4-[3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ]-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 92-2. 05 (2H, m), 2. 23-2. 34 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 01-4. 09 (2H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 31-7. 38 (2H, m), 7. 42 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 04-9. 11 (1H, m), 9. 30-9. 38 (1H, m), 9. 46 (1H, s).

5 実施例 688

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 30 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 94-2. 05 (2H, m), 2. 24-2. 34 (2H, m), 2. 95 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 01-4. 11 (2H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 6. 82 (1H, brs), 7. 34 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 46 (1H, brs), 9. 52-9. 60 (1H, m), 9. 82-9. 90 (1H, m).

実施例 689

15 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 03-1. 13 (4H, m), 1. 41 (9H, s), 1. 94-2. 05 (2H, m), 2. 24-2. 38 (3H, m), 4. 01-4. 09 (2H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 6. 83 (1H, brs), 7. 35 (1H, brs), 7. 44 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 47 (1H, brs), 9. 48-9. 56 (1H, m), 9. 62-9. 70 (1H, m).

実施例 690

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-6-プロポキシ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 0.99 (3H, t, J=7.2Hz), 1.41 (9H, s), 1.75-1.87 (2H, m), 1.93-2.02 (2H, m), 2.24-2.32 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 4.02-4.08 (2H, m), 4.13-4.20 (2H, m), 4.83 (2H, s), 5.46 (2H, s), 6.83 (1H, brs), 7.34 (1H, brs), 7.42 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.15-8.21 (1H, m), 8.52 (1H, s), 9.18 (1H, brs), 9.46 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

実施例 691

{6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸;
塩酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.26 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.68-1.74 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.38-3.46 (2H, m), 4.21 (2H, s), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 5.35 (2H, s), 6.57 (1H, d, J=8.0Hz), 7.52 (1H, s), 7.63 (1H, d, J=8.0Hz), 7.75 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.18 (1H, brs), 9.78 (1H, brs).

- 15 MS:m/e (ESI) 493.3 (MH⁺)

実施例 692

{6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸;
塩酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.26 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.39 (3H, t, J=7.2Hz), 1.68-1.74 (2H, m), 3.38-3.45 (2H, m), 4.07-4.22 (4H, m), 4.20 (2H, s), 4.77 (2H, s), 5.35 (2H, s), 6.57 (1H, d, J=8.4Hz), 7.31 (1H, s), 7.61 (1H, d, J=8.4Hz), 7.75 (1H, s), 8.99 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 498.3 (MH⁺)

- 25 実施例 693

{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ

-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;
トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 39 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 49-1. 57 (2H, m), 1. 63-1. 70 (4H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 88-2. 98 (4H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

実施例 694

10 {2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 39 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 95-3. 03 (4H, m), 3. 61-3. 68 (4H, m), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 82 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=5Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

実施例 695

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=7Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 50-1. 57 (2H, m), 1. 63-1. 71 (4H, m), 2. 88-2. 97 (4H, m), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 4. 86 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 62 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

25 実施例 696

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-酢酸;トリフルオ
ロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 31 (3H, t, J=7Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 2. 95-3. 03 (4H, m), 3. 71-3. 78 (4
H, m), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 52 (2H, s),
7. 35 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 33 (1H, brs).

実施例 697

10 4-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-酪酸 エチル
エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=6. 5Hz), 1. 32-1. 46 (12H, m), 1. 95-2. 08 (2H, m), 2. 57 (2H, t, J=7. 0Hz), 2
. 83 (3H, d, J=5. 0Hz), 4. 00-4. 10 (4H, m), 4. 26 (H, q, J=6. 5Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 45 (2H, s
, 7. 40 (1H, brs), 7. 48-7. 55 (2H, m), 8. 19 (1H, 5. 0Hz), 8. 54 (1H, s).

15 実施例 698

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-
オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 28 (2H, t, J=7. 5Hz), 2. 82 (3H
, s), 3. 89 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 26 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 50 (2H,
s), 6. 80 (1H, brs), 7. 37 (1H, brs), 7. 48-7. 55 (3H, m), 8. 17-8. 25 (1H, m), 8. 55 (1H, s),
9. 25 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

25 実施例 699

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-

オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸 アミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 35 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 07 (2H, m), 2. 24-2. 31 (2H, m), 3. 90 (3H, s)
, 4. 07 (2H, t, J=6. 5Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 6. 80 (1H, brs)
, 7. 37 (1H, brs), 7. 48-7. 54 (3H, m), 8. 63 (1H, s).

実施例 700

10 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-
オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 34 (9H, s), 1. 93-2. 08 (2H, m), 2. 24-2. 35 (2H, m), 2. 76 (3H, brs), 2. 82 (6H, s), 3. 89 (
3H, s), 4. 03-4. 12 (2H, m), 4. 74 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 14 (1H, s), 7. 36
(1H, brs), 7. 48-7. 56 (2H, m), 8. 07 (1H, s), 8. 31-8. 42 (1H, m), 9. 01 (1H, brs), 9. 57 (1H
, brs).

実施例 701

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化
水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 26 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 07 (2H, m), 2. 27 (2H
, t, J=6. 5Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 02-4. 15 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 4
8 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 51 (1H, s).

実施例 702

25 4-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化

水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 35 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 26 (2H, t, J=6. 5Hz), 3. 86 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 34-7. 39 (2H, m), 7. 50 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 9. 10 (1H, brs), 9. 38 (1H, brs).

実施例 703

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 30 (3H, t, J=7. 5Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 94-2. 08 (2H, m), 2. 27 (2H, t, J=7. 0Hz), 2. 94 (2H, q, J=7. 5Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 37 (1H, brs), 7. 50 (2H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 18 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 56 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

実施例 704

- 15 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 05-1. 12 (4H, m), 1. 35 (9H, s), 1. 94-2. 07 (2H, m), 2. 23-2. 36 (3H, m), 3. 89 (3H, s), 4. 06 (2H, t, J=5. 5Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 36 (1H, brs), 7. 51 (2H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 48-9. 55 (1H, m), 9. 64-9. 72 (1H, m).

実施例 705

- 25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 エチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 11 (3H, t, J=6.0Hz), 1. 24-1. 45 (12H, m), 1. 96-2. 07 (2H, m), 2. 22-2. 33 (2H, m), 3. 23-3. 39 (2H, m), 3. 89 (3H, s), 4. 02-4. 12 (2H, m), 4. 19-4. 30 (2H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 35 (1H, brs), 7. 51 (3H, brs), 8. 23 (1H, brs), 8. 52 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

実施例 706

4-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-カルボン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 54 (9H, s), 1. 62 (3H, t, J=7Hz), 3. 21 (3H, d, J=5Hz) 4. 06 (3H, s), 4. 37 (2H, q, J=7Hz), 4. 38 (3H, s), 5. 04 (2H, s), 6. 32 (2H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 25 (1H, s), 7. 84 (1H, d, J=2Hz), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 93 (1H, d, J=2Hz), 9. 56 (1H, s), 10. 44 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 520. 0 (MH⁺)

15 実施例 707

4-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 21 (3H, t, J=7Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 2. 01-2. 09 (2H, m), 2. 48-2. 57 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 07-4. 13 (2H, m), 4. 09 (2H, q, J=7Hz), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

実施例 708

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル

ル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (3H, t, J=7Hz), 1. 32 (3H, t, J=7Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 2. 00-2. 09 (2H, m), 2. 50-2. 56 (2H, m), 3. 88 (3H, s), 4. 09 (2H, q, J=7Hz), 4. 13 (2H, q, J=7Hz), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 71 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 56 (1H, s).

実施例 709

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92 (6H, s), 4. 04-4. 10 (2H, m), 4. 72 (2H, s), 5. 32 (2H, s), 6. 57 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 14 (1H, s), 7. 73 (1H, dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 77 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 05 (1H, s), 8. 36 (1H, t, J=4. 8Hz), 8. 90-8. 94 (1H, m), 9. 45-9. 50 (1H, m).

実施例 710

5-第 3 ブチル-7-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]ピロロ[2,1-b]オキサゾール-3a-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 27 (3H, J=7Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 61 (3H, t, J=7Hz), 1. 91 (1H, m), 2. 05 (1H, m), 2. 27 (1H, ddd, J=13, 7, 6Hz), 2. 72 (1H, ddd, J=13, 7, 6Hz), 3. 12 (3H, d, J=5Hz), 3. 44 (1H, ddd, J=15, 7, 6Hz), 3. 58 (1H, ddd, J=15, 7, 6Hz), 4. 23 (1H, dq, J=10, 7Hz), 4. 25 (1H, dq, J=10, 7Hz), 4. 45 (2H, brs), 4. 71 (1H, d, J=18Hz), 4. 99 (1H, d, J=18Hz), 5. 70 (1H, d, J=19Hz), 6. 46 (1H, d, J=19Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 72 (1H, s), 8. 30 (1H, q, J=5Hz), 9. 50 (1H, s), 10. 19 (1H, brs), 10. 36 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 563. 0 (MH⁺)

実施例 711

3-{4-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 20 (3H, t, J=7Hz), 1. 28 (3H, t, J=7Hz), 1. 57 (9H, s), 3. 03 (2H, t, J=7Hz), 3. 18 (2H, t, J=7Hz), 3. 19 (3H, d, J=5Hz), 3. 92 (3H, s), 4. 17 (2H, q, J=7Hz), 4. 37 (2H, q, J=7Hz), 5. 04 (2H, s), 6. 24 (2H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 76 (1H, s), 8. 04 (1H, q, J=5Hz), 8. 67 (1H, s), 9. 56 (1H, s), 10. 21 (1H, brs), 10. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 562. 0 (MH⁺)

10 実施例 712

{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 38 (9H, s), 2. 70 (6H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 66 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 9. 09 (1H, brs), 9. 31 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 502. 2 (MH⁺)

実施例 713

20 {2-(1-アミノ-1-メチル-エチル)-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 224 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 401 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 746 (6H, s), 2. 813 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 188 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 265 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 852 (2H, s), 5. 097 (2H, s), 5. 633 (2H, s), 7. 269 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 514 (1H, s), 7. 943 (1H, s), 8. 048 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 18-8. 24 (1H, m), 8. 560 (1H, s), 8. 587 (2H, s), 9. 658 (1H, s), 9. 999 (1H, s).

実施例 714

{2-(1-アミノ-1-メチル-エチル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 223 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 283 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 389 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 759 (6H, s), 4. 103 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 4. 15-4. 24 (4H, m), 4. 816 (2H, s), 5. 097 (2H, s), 5. 676 (2H, s), 7. 263 (1H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7. 329 (1H, s), 7. 954 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 8. 034 (1H, dd, $J=2.0, 8.8\text{Hz}$), 8. 668 (2H, s), 9. 141 (1H, s), 9. 765 (1H, s).

10 実施例 715

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1. 31 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1. 38 (9H, s), 2. 77 (3H, d, $J=4.4\text{Hz}$), 2. 92 (6H, s), 3. 70-3. 82 (2H, m), 3. 87 (2H, s), 4. 76 (2H, s), 5. 36 (1H, dd, $J=5.6, 2.0\text{Hz}$), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 56 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7. 92 (1H, dd, $J=8.0, 2.4\text{Hz}$), 8. 01 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 8. 07 (1H, s), 8. 38 (1H, q, $J=4.4\text{Hz}$), 11. 69 (1H, s).

実施例 716

20 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 36 (9H, s), 1. 42 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 93-2. 02 (2H, m), 2. 21-2. 28 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 03-4. 10 (2H, m), 4. 28 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 4. 85 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 6. 78 (1H, brs), 7. 33 (1H, brs), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 70 (1H, brs), 7. 78 (1H, brs), 8. 62 (

1H, s).

実施例 717

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28 (3H, t, J=7Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=7Hz), 1.93-2.02 (2H, m), 2.22-2.28 (2H, m), 3.87 (3H, s), 4.03-4.09 (2H, m), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q, J=7Hz), 4.80 (2H, s), 5.50 (2H, s), 6.78 (1H, brs), 7.32 (1H, brs), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.54 (1H, s).

実施例 718

2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7Hz), 1.93-2.02 (2H, m), 2.21-2.28 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=5Hz), 3.87 (3H, s), 4.03-4.10 (2H, m), 4.28 (2H, q, J=7Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 6.78 (1H, brs), 7.32 (1H, brs), 7.51 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.56 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=5Hz), 8.56 (1H, s).

実施例 719

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 1.78-1.84 (1H, m), 1.97-2.05 (1H, m), 2.91 (1H, brd, J=10.4Hz), 3.04-3.09 (1H, m), 3.21-3.40 (2H, m), 4.11 (2H, q

, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.32 (2H, ABq, J=16.0Hz), 4.34 (1H, br), 4.78 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.44 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 572.4 (MH⁺)

実施例 720

- 5 [2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.08-1.10 (4H, m), 1.38 (9H, s), 1.77-1.84 (1H, m), 1.99-2.06 (1H, m), 2.08-2.16 (1H, m), 2.90-2.96 (1H, m), 3.03-3.09 (1H, m), 3.29-3.40 (2H, m), 4.35 (1H, br), 4.39 (2H, ABq, J=15.6Hz), 4.82 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.37 (1H, d, J=2.0Hz), 7.45 (1H, d, J=2.4Hz), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.47 (1H, brs), 9.66 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 507.4 (MH⁺)

実施例 721

- 15 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.94-2.01 (1H, m), 2.07-2.14 (1H, m), 2.94 (1H, brd, J=8.0Hz), 3.01-3.17 (2H, m), 3.37-3.42 (1H, m), 3.97 (2H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.25 (1H, br), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, d, J=8.0Hz), 7.32 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.70 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 572.3 (MH⁺)

実施例 722

- 25 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イ

ルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.10 (4H, m), 1.39 (9H, s), 1.95-2.01 (1H, m), 2.10-2.15 (1H, m), 2.28-2.33 (1H, m), 2.94 (1H, brd, J=7.6Hz), 3.01-3.06 (1H, m), 3.09-3.14 (1H, m), 3.41 (1H, br), 4.00 (2H, s), 4.27 (1H, br), 4.81 (2H, s), 4.53 (2H, d, J=6.0Hz), 7.58 (1H, s), 7.69 (1H, s), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 8.09 (1H, d, J=8.4Hz).

MS:m/e (ESI) 507.3 (MH⁺)

実施例 723

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸
エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.00-1.14 (4H, m), 1.17 (3H, d, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.80-1.97 (4H, m), 1.99-2.12 (2H, m), 2.26-2.37 (1H, m), 2.43-2.55 (2H and DMSO, m), 3.05-3.18 (4H, m), 3.75-3.93 (2H, m), 4.05 (2H, q, J=6.8Hz), 4.81 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 8.09 (1H, d, J=8.0Hz), 9.46 (1H, brs), 9.65 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 547.4 (MH⁺)

実施例 724

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペン
タン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.05-1.14 (4H, m), 1.16 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.63-2.00 (8H, m), 2.27-2.42 (3H, m), 3.06-3.19 (4H, m), 3.75-3.93 (2H, m), 4.04 (2H, q, J=6.8Hz), 4.81 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.71 (1H, d, J=8.0Hz), 8.09 (1H, d, J=8.0Hz), 9.45 (1H, brs), 9.65 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 561.4 (MH⁺)

実施例 725

4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.17 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.82-1.96 (4H, m), 1.99-2.11 (2H, m), 2.44-2.55 (2H and DMSO, m), 3.05-3.18 (4H, m), 3.78-3.91 (5H, m), 3.95 (3H, s), 4.05 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.36 (1H, s), 7.45 (1H, s).

10

MS:m/e (ESI) 584.3 (MH⁺)

実施例 726

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.16 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.62-1.99 (8H, m), 2.32-2.43 (2H, m), 3.03-3.20 (4H, m), 3.77-3.92 (5H, m), 3.95 (3H, s), 4.04 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.36 (2H, s), 7.45 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.29 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 598.4 (MH⁺)

20

実施例 727

4-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25

1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.04-2.08 (2H, m), 2.48-2.53 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.89 (3H, s), 4.04-4.12 (4H, m), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz)

), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.50-7.56 (2H, m), 8.21 (1H, d, J=5.2Hz), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 568.3 (MH⁺)

実施例 728

5 4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.03-2.08 (2H, m), 2.47-2.53 (2H, m), 3.88 (3H, s), 4.04-4.14 (6H, m), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz)
10), 4.80 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, d, J=2.0Hz), 7.52 (1H, d, J=2.0Hz)

MS:m/e (ESI) 573.3 (MH⁺)

実施例 729

15 4-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 2.05-2.08 (2H, m), 2.45-2.54 (2H, m), 3.87 (3H, s),
20 , 3.89 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.04-4.12 (4H, m), 4.81 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.37 (1H, s),
7.48-7.54 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 545.3 (MH⁺)

実施例 730

25 4-{8-第3ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 78-1. 85 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 32-3. 38 (4H, m), 4. 04 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 23-4. 28 (2H, m), 4. 74 (1H, s), 5. 44 (1H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 22 (2H, s), 8. 08 (1H, s), 8. 38 (1H, d, J=4. 8 Hz).

5 MS:m/e (ESI) 578. 4 (MH⁺)

実施例 731

4-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 78-1. 84 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 30-3. 38 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 98 (3H, s), 4. 04 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 23-4. 28 (2H, m), 4. 80 (1H, s), 5. 47 (1H, s), 7. 21 (2H, s), 7. 36 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 556. 3 (MH⁺)

15 実施例 732

4-({3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-メチル-アミノ)-酪酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 16 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 65 (2H, quint, J=7. 2Hz), 2. 36 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 56 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (1H, t, J=7. 2Hz), 4. 03 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 7. 77 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 22 (1H, s), 9. 86 (1H, s).

実施例 733

25 2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-{[3-(ヒドロキシメチル-カルバモイル)-プロピル]-メチル-アミノ}-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ

-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 62 (2H, quint, J=7. 2Hz), 2. 10 (2H, t, J=7. 2Hz),
 2. 57 (3H, s), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 87 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 47
 5 (2H, t, J=6. 0Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 46 (2H, d), 5. 51 (1H, t, J=6. 0Hz) 7. 55 (1H, s), 7. 68 (1
 H, s), 7. 75 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 46 (1H, t, J=6. 0Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 17 (1H
 , s), 9. 83 (1H, s).

実施例 734

10 2-[2-(7-第 3 ブチル-2-メチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキソ-エチ
 ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチ
 ルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 72 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 30 (2H, q, J=
 6. 8Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 61 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 85 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 23 (1H, q, J=4
 15 . 4Hz), 8. 28 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 59 (1H, s), 9. 26 (1H, s), 9. 89 (1H, s).

実施例 735

20 {5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドー
 ル-2-イル)-アセチル]-1,3,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-2-イ
 ル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 072 (6H, s) 1. 202 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 401 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 57-2. 74 (2H, m), 2. 815
 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 608 (1H, t, J=6. 4Hz), 4. 116 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 265 (2H, d, J=6. 8H
 z), 4. 830 (2H, s), 5. 381 (2H, s), 6. 608 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 516 (1H, s), 7. 612 (1H, d, J=
 1. 6Hz), 7. 785 (1H, dd, J=1. 6, 8. 4Hz), 8. 213 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 537 (1H, s), 9. 224 (1H
 25 , s), 9. 814 (1H, s).

実施例 736

{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-1,3,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-2-イル}-酢酸エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.072 (6H, s), 1.203 (3H, t, J=7.2Hz), 1.282 (3H, t, J=6.8Hz), 1.387 (3H, t, J=6.8Hz), 2.57-2.74 (2H, m), 3.606 (1H, t, J=6.4Hz), 4.07-4.15 (4H, m), 4.201 (2H, d, J=7.2Hz), 4.778 (2H, s), 5.364 (2H, s), 6.606 (1H, d, J=8.0Hz), 7.312 (1H, s), 7.600 (1H, d, J=1.6 Hz), 7.785 (1H, dd, J=1.6, 8.0Hz).

実施例 737

- 10 {(2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.44 (9H, s), 2.62 (3H, s), 3.50 (2H, s), 4.10 (2H, q, J=7.2Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.80 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.65 (1H, d, J=8.4Hz), 7.89 (1H, d, J=8.4Hz), 7.93 (1H, s), 9.02-9.10 (1H, m), 9.23-9.34 (1H, m).

実施例 738

- 20 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.23 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.78-1.84 (1H, m), 1.98-2.09 (1H, m), 2.73-2.77 (1H, m), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 2.78-2.84 (1H, m), 2.90-2.97 (1H, m), 3.03-3.09 (1H, m), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.35 (1H, br,), 4.60 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.40 (1H, s), 7.47 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.21 (1H

, brs), 8.56 (1H, br), 9.36 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 595.5 (MH⁺)

実施例 739

5 [2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.10 (4H, m), 1.23 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.77-1.84 (1H, m), 1.97-2.05 (1H, m), 2.29-2.35 (1H, m), 2.93 (1H, brd, J=10.0Hz), 3.02-3.09 (1H, m), 3.26-3.42 (2H, m), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.33 (1H, brs), 4.49 (2H, ABq, J=15.6Hz), 4.82 (2H, s), 5.81 (2H, s), 7.40 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.4Hz), 8.09 (1H, d, J=8.4Hz), 9.60 (1H, br), 9.67 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 535.3 (MH⁺)

実施例 740

15 [2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.19 (3H, t, J=6.8Hz), 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, brs), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.93-2.02 (1H, m), 2.10-2.19 (1H, m), 2.92 (1H, dd, J=4.0, 10.0Hz), 2.99-3.04 (1H, m), 3.12 (1H, dd, J=7.6, 15.6Hz), 3.44 (1H, dd, J=6.4, 10.0Hz), 4.01 (1H, q, J=6.8Hz), 4.12 (2H, q, J=6.8Hz), 4.15 (2H, s), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.28 (1H, br), 4.78 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.59 (1H, s), 7.63 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 600.5 (MH⁺)

25 実施例 741

(1-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ

ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン
-3-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 94-2. 02 (1H, m), 2. 11-2. 18 (1H, m), 2. 82 (3H, d, J=3. 6Hz), 2. 94-2. 98 (1H, m), 3. 03-3. 09 (1H, m), 3. 12-3. 19 (1H, m), 3. 45-3. 49 (1H, m), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 25 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 62 (1H, s), 7. 66 (1H, s), 8. 21 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 38 (1H, br), 9. 93 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 595. 4 (MH⁺)

10 実施例 742

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イ
ルオキシ)-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 96-2. 03 (1H, m), 2. 12-2. 17 (1H, m), 2. 28-2. 34 (1H, m), 2. 98 (1H, brd, J=9. 2Hz), 3. 06-3. 11 (1H, m), 3. 13-3. 19 (1H, m), 3. 49 (1H, dd, J=5. 2, 9. 6Hz), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 16 (2H, s), 4. 30 (1H, brs), 4. 82 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 62 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 61 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 535. 3 (MH⁺)

実施例 743

2,2-ジメチル-プロピオン酸 2-{2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチ
ルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジ
ン-1-イル)-フェノキシ}-アセトキシメチルエステル;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (9H, s), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 84-1. 89 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8

Hz), 3.06-3.12 (4H, m), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.58 (2H, s), 4.83 (2H, s), 5.49 (2H, s), 5.83 (2H, s), 7.43 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 665.4 (MH⁺)

5 実施例 744

2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(1,2,3,3-テトラメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.02 (3H, s), 1.14 (3H, d, J=6.4Hz), 1.21-1.30 (9H, m), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.79 (3H, s), 3.10-3.20 (1H, m), 4.10 (2H, q, J=6.8Hz), 4.19 (2H, q, J=6.8Hz), 4.76 (2H, s), 5.33 (2H, s), 6.59 (1H, d, J=8.4Hz), 7.31 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.75 (1H, d, J=8.4Hz).

MS:m/e (ESI) 454.2 (MH⁺)

実施例 745

15 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.27 (3H, t, J=7Hz), 1.31 (3H, t, J=7Hz), 1.39 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.95-3.01 (4H, m), 3.69-3.77 (4H, m), 4.13 (2H, q, J=7z), 4.23 (2H, q, J=7Hz), 4.25 (2H, q, J=7Hz), 4.81 (2H, s), 4.92 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.66 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

実施例 746

25 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 86-1. 96 (1H, m), 2. 02-2. 12 (1H, m), 2. 89-2. 95 (1H, m), 3. 01-3. 18 (2H, m), 3. 36-3. 42 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 3. 99 (2H, brs), 4. 23-4. 27 (1H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, d, J=7. 2Hz), 7. 35 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 70 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH⁺)

実施例 747

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 19 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 96-2. 02 (1H, m), 2. 11-2. 19 (1H, m), 2. 94-2. 97 (1H, m), 3. 02-3. 09 (1H, m), 3. 12-3. 18 (1H, m), 3. 47 (1H, dd, J=6. 0, 10. 4Hz), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 27-4. 32 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 9. 09 (1H, s), 9. 45 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 748

3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロパン酸 メチルエステル;塩酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (9H, s), 2. 84 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 19-3. 27 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 31 (2H, brs), 4. 80 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 86 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 9. 08 (1H, s), 9. 13-9. 17 (1H, m), 9. 45 (1H, s), 10. 20 (1H, s).

25 MS:m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

実施例 749

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 1.88-1.98 (1H, m), 2.13-2.21 (2H, m), 2.28-2.38 (1H, m), 3.78-3.84 (1H, m), 4.12 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.23 (1H, brs), 4.71 (1H, d, J=14.4Hz), 4.78 (2H, s), 5.40 (2H, s), 7.32 (1H, s), 7.69 (1H, s), 7.73 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 570.4 (MH⁺)

10 実施例 750

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.02-2.09 (1H, m), 2.32-2.45 (3H, m), 3.64 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.29 (1H, d, J=17.6Hz), 4.39-4.45 (1H, m), 4.63 (1H, d, J=14.4Hz), 4.79 (2H, s), 5.49 (2H, d, J=8.4Hz), 7.33 (1H, s), 7.72 (1H, s), 7.78 (1H, s), 9.06 (1H, s), 9.46 (1H, s), 10.03 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 584.3 (MH⁺)

20 実施例 751

(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.35 (9H, s), 1.96 (3H, s), 2.49 (2H, s), 3.86 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.39 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.76 (1H, s), 7.88 (1H, s), 8.31 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 530. 2 (MH⁺)

実施例 752

(4-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸

5 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 32 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 35-2. 55 (8H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 0Hz), 3. 18 (2H, s), 3. 56 (2H, s), 4. 05 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 7. 87 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 0), 8. 56 (1H, s), 9. 28 (1H, brs).

10

MS:m/e (ESI) 592. 5 (MH⁺)

実施例 753

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-メトキシカルボニルイミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル

15

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 41 (9H, s), 1. 55 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 88-1. 95 (4H, m), 3. 01 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 08-3. 25 (4H, m), 3. 85 (3H, s), 4. 19-4. 35 (4H, m), 4. 51 (2H, s), 4. 62 (2H, s), 5. 10 (2H, s), 6. 99 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 64-7. 73 (1H, m), 8. 81 (1H, s).

20

MS:m/e (ESI) 637. 4 (MH⁺)

実施例 754

2-[2-(7-第 3 ブチル-2-メトキシメチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸

25

メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 45 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50 (9H, s), 2. 86 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 47 (3H, s), 4. 31 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 82 (2H, s), 4. 92 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 91 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 39 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 61 (1H, s), 9. 30 (1H, m), 9. 92 (1H, m).

実施例 755

- 5 7-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾオキサゾール e-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

- 10 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 52 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 49 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 92 (2H, s), 5. 63 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 02 (1H, s), 8. 24 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 57 (1H, s), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, s), 9. 91 (1H, s).

実施例 756

- 15 {3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジルオキシ}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

1. 33 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (2H, d, J=4. 8), 4. 13 (2H, s), 4. 26 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 64 (2H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 7. 82 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 8Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 24 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

20 実施例 757

- 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR(DMSO-d6) δ :

- 25 1. 42 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 11 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 12 (2H, t, J=5. 6Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 55 (2H, s), 8.

22 (1H, m), 8.59 (1H, s), 9.21 (1H, m), 9.86 (1H, m).

実施例 758

2-(2-{3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-[3-(2-メトキシ-エトキシ)-プロポキシ]-
フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
 5 ドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.45 (9H, s), 1.53 (3H, t, J=7.2Hz), 2.11 (2H, m), 3.30 (3H, s), 3.54 (2H, m), 3.61 (2H, m), 3.69 (2H, t, J=7.2Hz), 4.22 (4H, m), 4.36 (2H, q, J=7.2Hz), 4.90 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.48 (1H, sz), 7.52 (1H, s), 7.67 (1H, s), 8.54 (1H, s).

10 実施例 759

{4-[2-(1-アセトキシメトキシカルボニルイミノ-5-エトキシ-6-メチルカルバモ
イル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-第 3 ブチル-6-(ピロ
リジン-1-イル)-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.33 (3H, t, J=7.2Hz), 1.42 (9H, s), 1.55 (3H, t, J=7.2Hz), 1.87-1.97 (4H, m), 2.15 (3H, s), 3.00 (3H, d, J=4.8Hz), 3.11-3.22 (4H, m), 4.18-4.36 (4H, m), 4.51 (2H, s), 4.64 (2H, s), 5.14 (2H, s), 5.88 (2H, s), 6.99 (1H, s), 7.44 (1H, s), 7.50-7.65 (2H, m), 8.88 (1H, s).

実施例 760

20 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-カ
ルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.10 (3H, t, J=7Hz), 1.41 (9H, s), 1.54 (3H, t, J=7Hz), 1.91-2.13 (3H, m), 2.45 (1H, q, J=7Hz), 3.13 (3H, d, J=5Hz), 3.32 (1H, br. t, J=7Hz), 3.74 (1H, br. t, J=7Hz), 3.75 (3H, s), 4.01 (1H, qd, J=7, 2Hz), 4.02 (1H, qd, J=7, 2Hz), 4.46 (2H, brs), 4.58 (1H, t, J=7Hz),

4. 86 (2H, s), 6. 12 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=2Hz), 7. 66 (1H, d, J=2Hz), 8. 30 (1H, m), 9. 50 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 579. 0 (MH⁺)

実施例 761

- 5 1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 24 (6H, t, J=7Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 53 (3H, t, J=7Hz), 1. 92-2. 12 (3H, m), 2. 42-2. 49 (1H,), 3. 35 (1H, t, J=6Hz), 3. 71 (1H, t, J=6Hz), 3. 73 (3H, s), 4. 01 (2H, m), 4. 18 (4H, q, J=7Hz), 4. 60 (1H, t, J=6Hz), 4. 77 (2H, s), 6. 09 (2H, s), 6. 85 (1H, s), 7. 62 (2H, s).

MS:m/e (ESI) 584. 0 (MH⁺)

実施例 762

- 15 1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-カルボン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 11 (3H, t, J=7Hz), 1. 15-1. 25 (4H, m), 1. 40 (9H, s), 1. 92-2. 11 (4H, m), 2. 15-2. 21 (1H, m), 2. 41-2. 49 (1H, m), 3. 35 (1H, t, J=7Hz), 3. 71 (1H, t, J=7Hz), 3. 73 (3H, s), 4. 01 (1H, qd, J=7, 4Hz), 4. 02 (1H, qd, qd, J=7, 4Hz), 4. 60 (1H, t, J=7Hz), 4. 82 (2H, s), 6. 20 (2H, s), 7. 54 (1H, d, J=8Hz), 7. 63 (1H, d, J=2Hz), 7. 64 (1H, d, J=2Hz), 7. 79 (1H, d, J=8Hz).

MS:m/e (ESI) 519. 0 (MH⁺)

実施例 763

- 25 {4-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24 (3H, t, 7Hz), 1. 41 (3H, t, J=7Hz), 1. 57 (9H, s), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 4. 19 (2H, q, J=7H), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 37 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 71 (1H, d, =2Hz), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 26 (1H, d, J=2Hz), 8. 44 (1H, s), 8. 57 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 534. 0 (MH⁺)

実施例 764

{4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 21 (3H, t, J=7Hz), 1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 55 (3H, t, J=7Hz), 1. 60 (9H, s), 4. 18-4. 25 (4H, m), 4. 23 (2H, q, J=7Hz), 5. 02 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 6. 14 (2H, s), 6. 90 (1H, s), 7. 00 (1H, s), 7. 98 (1H, s), 8. 54 (1H, brs), 8. 99 (1H, brs), 10. 78 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 539. 0 (MH⁺)

15 実施例 765

{4-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 12-1. 24 (4H, m), 1. 35 (3H, t, J=7Hz), 1. 60 (9H, s), 2. 17-2. 24 (1H, m), 4. 32 (2H, q, J=7Hz), 5. 05 (2H, s), 5. 29 (2H, s), 6. 23 (2H, s), 7. 31 (1H, brs), 7. 37 (1H, d, J=8Hz), 7. 82 (1H, d, J=2Hz), 7. 84 (1H, d, J=8Hz), 8. 08 (1H, s), 8. 85 (1H, d, J=2Hz).

MS:m/e (ESI) 474. 0 (MH⁺)

実施例 766

25 2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 95-2. 04 (2H, m), 2. 23-2. 30 (2H, m), 2. 79 (3H, d, J=5Hz), 2. 93 (6H, s), 3. 89 (2H, s), 4. 05-4. 11 (2H, m), 4. 76 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 17 (1H, s), 7. 34 (1H, brs), 7. 52 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 38 (1H, q, J=5Hz).

実施例 767

2-{2-[7-第3ブチル-2-(2-シアノ-エチル)-ベンゾオキサゾール-5-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 10 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 12 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 45 (2H, t, J=6. 4Hz), 4. 31 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 61 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 88 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 37 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 90 (1H, m).

- 15 実施例 768

2-{2-[7-第3ブチル-2-(2-カルバモイル-エチル)-ベンゾオキサゾール-5-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 20 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 71 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 23 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 6. 93 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 84 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 28 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 91 (1H, m).

実施例 769

- 25 3-{7-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-アセチル}-ベンゾオキサゾール-2-イル}-プロパン

酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 49 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 88 (2H, t, J=7. 6Hz), 3. 27 (2H, t, J=7. 6Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 85 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 23 (1H, m), 8. 31 (1H, d, J=1. 2Hz), 8. 60 (1H, s), 9. 28 (1H, m), 9. 90 (1H, m).

実施例 770

- 2-{2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(3-メチルカルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 97-2. 06 (2H, m), 2. 26-2. 35 (2H, m), 2. 58 (3H, d, J=5Hz), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 4. 03-4. 10 (2H, m), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 72 (1H, q, J=5Hz), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 57 (1H, s).

実施例 771

- 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ジメチルカルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 96-2. 06 (2H, m), 2. 52-2. 59 (2H, m), 2. 83 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 98 (3H, s), 4. 06-4. 14 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 772

- 2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(3-メチルカルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 98-2. 08 (2H, m), 2. 26-2. 33 (2H, m), 2. 57 (3H, d, J=5Hz), 2. 84 (3H, d, J=5Hz), 3. 92 (3H, s), 4. 05-4. 12 (2H, m), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 56 (2H, s), 7. 78-7. 88 (1H, m), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

実施例 773

2-[2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ジメチルカルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 98-2. 08 (2H, m), 2. 45-2. 56 (2H, m), 2. 83 (3H, s), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 2. 98 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 4. 08-4. 16 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 55 (3H, s), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 58 (1H, s).

15 実施例 774

2-[2-(7-第 3 ブチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 50 (9H, s), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 31 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 8. 23 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 45 (1H, s), 8. 59 (1H, s), 8. 98 (1H, s), 9. 26 (1H, s), 9. 90 (1H, s).

実施例 775

{5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-7-メトキシ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (6H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 76 (3H, s), 4. 27 (2H, s), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 39 (2H, s), 7. 32 (1H, d, J=1. 2Hz), 7. 42 (1H, d, J=1. 2Hz), 7. 55 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 21 (1H, m), 9. 83 (1H, m).

5 実施例 776

2-{2-[3-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 44 (3H, t, J=7Hz), 1. 90-2. 01 (2H, m), 2. 21-2. 28 (2H, m), 2. 85 (3H, d, J=5Hz), 4. 03-4. 10 (2H, m), 4. 30 (2H, q, J=7Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 03 (2H, s), 6. 80 (1H, brs), 7. 29-7. 37 (2H, m), 7. 48-7. 57 (3H, m), 7. 49-7. 54 (1H, m), 8. 23 (1H, q, J=5Hz), 8. 59 (1H, s).

実施例 777

15 {2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 88 (3H, s), 3. 77 (3H, s), 3. 99 (2H, s), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 32 (2H, s), 7. 38 (1H, dd, J=7. 2, 1. 6Hz), 7. 60 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 45 (1H, s).

実施例 778

25 (({2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (3H, t, J=6.4Hz), 1.44 (9H, s), 2.67 (3H, s), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.28 (1H, d, J=20Hz) 4.05 (1H, d, J=20Hz), 4.28 (2H, q, J=6.4Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.47 (1H, d, J=2.0Hz) 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, d, J=2.0Hz), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.16-9.20 (1H, m), 9.83-9.88 (1H, m).

5 実施例 779

2-[2-(7-第3ブチル-3-シアノメチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキシノ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.42 (3H, t, J=7Hz), 1.57 (9H, s), 2.85 (3H, d, J=4Hz), 4.29 (2H, q, J=7Hz), 4.91 (2H, s), 5.49 (2H, s), 5.74 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.78 (1H, d, J=1Hz), 8.22 (1H, q, J=4Hz), 8.39 (1H, d, J=1Hz), 8.56 (1H, s), 8.59 (1H, s), 9.28 (1H, s), 9.48 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 487.0 (MH⁺)

実施例 780

15 {4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトニトリル;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.30 (3H, t, J=7Hz), 1.40 (3H, t, J=7Hz), 1.55 (9H, s), 4.13 (2H, q, J=7Hz), 4.22 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.48 (2H, s) 5.75 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.77 (1H, d, J=2Hz), 8.37 (1H, d, J=2Hz), 8.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 492.0 (MH⁺)

実施例 781

25 {4-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトニトリル;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 05-1. 16 (4H, m), 1. 56 (9H, s), 2. 30-2. 37 (1H, m), 4. 89 (2H, s), 5. 65 (2H, s), 5. 74 (2H, s), 7. 74 (1H, d, J=8Hz), 7. 78 (1H, d, J=2Hz), 8. 12 (1H, d, J=8Hz), 8. 39 (1H, d, J=2Hz), 8. 57 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 427. 0 (MH⁺)

実施例 782

2-{2-[3-アセチルアミノ-5-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36-1. 43 (12H, s), 2. 01-2. 07 (2H, m), 2. 13 (3H, s), 2. 27 (2H, t, J=7. 2), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 87 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 28 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 6. 86 (1H, s), 7. 38 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=2. 0), 8. 17-8. 23 (2H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 65 (1H, s), 9. 83 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 566. 3 (MH⁺)

実施例 783

2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-シアノ-プロポキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 17 (2H, m), 2. 73 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 23 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 22 (1H, d, J=9. 2Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 87 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 94 (1H, dd, J=2. 0, 9. 2Hz), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s).

25 実施例 784

2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキ

シ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.34 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.84 (3H, d, J=4.4Hz), 2.99 (6H, s), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.06 (1H, s), 7.12 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.56 (1H, s), 8.23 (1H, q, J=4.4Hz), 8.58 (1H, s), 9.24 (1H, s), 9.85 (1H, s).

実施例 785

10 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.20-1.50 (12H, m), 1.93-2.07 (1H, m), 2.10-2.23 (1H, m), 2.77 (3H, d, J=5.1Hz), 2.94-3.05 (1H, m), 3.06-3.24 (2H, m), 3.43-3.54 (1H, m), 4.07 (3H, s), 4.14-4.55 (5H, m), 4.87 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.61 (1H, s), 7.69 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.52-8.62 (1H, s), 9.54 (1H, brs), 9.95 (1H, brs).

実施例 786

20 3-(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロパン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.23-1.46 (12H, m), 2.16 (3H, s), 2.60-2.83 (5H, m), 3.51-3.69 (2H, m), 4.15-4.32 (2H, m), 4.48 (2H, brs), 4.88 (2H, brs), 5.57 (2H, brs), 7.81 (1H, s), 7.93 (2H, brs), 7.99 (1H, brs), 8.55-8.64 (1H, m), 9.97 (1H, brs).

実施例 787

25 4-[2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェノキシ]-ブ

チルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 73 (4H, br), 2. 02 (2H, br), 2. 27 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 58 (3H, s), 3. 14 (2H, br), 3. 24-3. 40 (2H, br), 3. 83 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 53 (2H, s), 4. 60 (2H, s), 5. 15 (2H, s), 6. 81 (1H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 46 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 56 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 87 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 95 (1H, d, J=8. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 534. 3 (MH⁺)

実施例 788

2-[2-(7-第 3 ブチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 43 (3H, t, J=7Hz), 1. 54 (9H, s), 2. 74 (3H, d, J=5Hz), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 57 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 8. 16 (1H, brs), 8. 22 (1H, q, J=5Hz), 8. 45 (1H, s), 8. 57 (1H, s), 9. 23 (1H, s), 9. 45 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 448. 0 (MH⁺)

実施例 789

2-[2-(7-第 3 ブチル-3-メチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (3H, t, J=7Hz), 1. 55 (9H, s), 2. 74 (3H, d, J=4Hz), 3. 94 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=7Hz), 4. 89 (2H, s), 5. 60 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4Hz), 8. 23 (1H, s), 8. 42 (1H, s), 8. 58 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 462. 0 (MH⁺)

実施例 790

2-[2-(7-第3-ブチル-3-カルバモイルメチル-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.42 (3H, t, J=7Hz), 1.58 (9H, s), 2.83 (3H, d, J=5Hz), 4.29 (2H, q, J=7Hz), 4.89 (2H, s), 5.13 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.38 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.70 (1H, d, J=2Hz), 7.82 (1H, s), 8.12 (1H, d, J=2Hz), 8.22 (1H, q, J=5Hz), 8.39 (1H, s), 8.58 (1H, s), 9.26 (1H, d, J=4Hz), 9.85 (1H, d, J=4Hz).

MS:m/e (ESI) 505.0 (MH⁺)

10 実施例 791

2-{4-第3-ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.28 (3H, t, J=7Hz), 1.40 (3H, t, J=7Hz), 1.56 (9H, s), 4.12 (2H, q, J=7Hz), 4.22 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.03 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.67 (1H, s), 7.82 (1H, s), 8.10 (1H, s), 8.39 (1H, s), 9.04 (1H, brs), 9.39 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 510.0 (MH⁺)

実施例 792

- 20 2-{4-第3-ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-アセトアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.05-1.13 (4H, m), 2.33 (1H, quint, J=7Hz), 1.57 (9H, s), 4.86 (2H, s), 5.03 (2H, s), 5.62 (2H, s), 7.38 (1H, s), 7.70 (1H, s), 7.73 (1H, d, J=8Hz), 7.81 (1H, s), 8.10 (1H, d, J=8Hz), 8.11 (1, s), 8.39 (1H, s), 9.53 (1H, brs), 9.66 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 445.0 (MH⁺)

実施例 793

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 41 (12H, m), 2. 63 (6H, s), 2. 84 (2H, s), 4. 30 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 66 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 22 (1H, s), 8. 57 (1H, s), 9. 17 (1H, s), 9. 84 (1H, s).

10

実施例 794

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15

1. 01-1. 15 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 1. 82-2. 08 (6H, m), 2. 28-2. 43 (3H, m), 2. 82-3. 42 (4H, m), 3. 78-3. 94 (2H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 68-7. 75 (1H, m), 8. 06-8. 12 (1H, m), 9. 44 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 519.3 (MH⁺)

実施例 795

20

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25

1. 00-1. 15 (4H, m), 1. 38 (9H, s), 1. 59-1. 85 (4H, m), 2. 23-2. 37 (3H, m), 3. 03-3. 20 (4H, m), 3. 78-3. 88 (2H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 41-9. 49 (1H, m), 9. 61-9. 70 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 533. 3 (MH⁺)

実施例 796

4-{4-[2-(1-アミノ-7-フルオロ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-第 3 ブチル-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸;
5 トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 79-1. 96 (4H, m), 2. 01 (2H, t, J=6. 8Hz), 2. 41 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 02-3. 20 (4H, m), 3. 77-3. 90 (5H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 35 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 36 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 03-9. 11 (1H, m), 9. 27-9. 34 (1H, m).

10 実施例 797

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 55-1. 99 (8H, m), 2. 17-2. 36 (2H, m), 2. 94-3. 20 (4H, m), 3. 57-4. 27 (8H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 36 (2H, s), 7. 45 (1H, s), 9. 01-9. 11 (1H, m), 9. 22-9. 35 (1H, m).

実施例 798

20 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 41 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 13 (2H, m), 2. 75 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 80 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 11-4. 19 (4H, m), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 76 (2H, m), 7. 59 (1H, s), 8. 22 (1H, m), 8. 59 (1H, s), 9. 21 (1H, m).

実施例 799

2,6-ジ第3ブチル-4-[1-ヒドロキシ-2-(3-イミノ-5,6-ジメトキシ-3H-ベンゾ[d]イソキサゾール-2-イル)-ビニル]-フェノール;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.45 (18H, s), 3.90 (3H, s), 4.07 (3H, s), 5.96 (1H, s), 6.27 (1H, brs), 6.52 (1H, s), 7.84 (1H, s), 7.98 (2H, s), 9.55-9.66 (2H, m), 9.80 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 441.1 (MH⁺)

実施例 800

2-[2-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
 10 メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.41 (12H, m), 1.94 (4H, s), 2.84 (3H, s), 3.02 (4H, s), 4.30 (2H, q, 6.4Hz), 4.86 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.56 (1H, s), 7.62 (1H, s), 7.65 (1H, s), 8.23 (1H, s), 8.57 (1H, s), 9.18 (1H, s), 9.84 (1H, s).

15 実施例 801

({3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.32 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.84 (3H, d, J=4.4Hz), 3.06 (3H, s), 4.21 (2H, s), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.87 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.01 (1H, s), 7.07 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.55 (1H, s), 8.22 (1H, q, J=4.4Hz), 8.58 (1H, s), 9.33 (1H, s), 9.89 (1H, s).

実施例 802

({3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸 エチル
 25 エステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, t, J=7.2Hz), 1.32 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.84 (3H, d, J=4.4Hz), 3.08 (3H, s), 4.10 (2H, q, J=7.2Hz), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.32 (2H, s), 4.87 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.00 (1H, s), 7.08 (1H, s), 7.36 (1H, s), 7.56 (1H, s), 8.23 (1H, q, J=4.4Hz), 8.58 (1H, s), 9.30 (1H, s), 9.88 (1H, s).

5 実施例 803

4-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.38 (9H, s), 1.95-2.05 (2H, m), 2.28 (2H, t, J=7.2Hz), 2.57 (3H, s), 4.04-4.10 (2H, m), 4.68 (2H, s), 4.85 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.03 (1H, s), 7.15 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.44 (1H, d, J=1.6Hz), 7.52 (1H, d, J=1.6Hz), 8.19 (1H, s), 9.45-9.51 (1H, m), 9.84-9.90 (1H, m).

実施例 804

15 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-ヒドロキシメチル-7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.38 (9H, s), 1.85-1.92 (4H, m), 2.01 (2H, m), 2.40 (2H, t, J=7.2Hz), 2.57 (3H, s), 3.08-3.15 (4H, m), 3.85 (2H, t, J=7.2Hz), 4.69 (2H, s), 4.85 (2H, s), 5.54 (2H, s), 5.67 (1H, s), 7.36 (1H, d, J=1.6Hz), 7.46 (1H, d, J=1.6Hz), 8.20 (1H, s).

実施例 805

25 4-({2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 04-1. 12 (4H, m), 1. 42 (9H, s), 1. 70-1. 82 (2H, m), 2. 44 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 52 (3H, s), 2. 70-2. 80 (2H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 58 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 71 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 90 (1H, dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 94 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 09 (1H, dd, J=8. 4Hz), 9. 44-9. 50 (1H, m), 9. 63-9. 68 (1H, m).

5 実施例 806

4-({2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 43 (9H, s), 1. 70-1. 82 (2H, m), 2. 24 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 51 (3H, s), 2. 70-2. 80 (2H, m), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 57 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 88 (1H, d, J=8. 4 Hz), 7. 93 (1H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 29 (1H, brs).

実施例 807

15 1-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-イミノ-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-インドール-1-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 48 (18H, s), 1. 60 (6H, m), 5. 77 (2H, s), 7. 27 (1H, t, J=7. 2Hz), 7. 35 (1H, t, J=7. 2Hz), 7. 40 (1H, d, J=7. 2Hz), 7. 54 (1H, d, J=7. 2Hz), 7. 58 (2H, s), 8. 10 (1H, brs), 9. 88 (1H, br s), 10. 04 (1H, brs).

実施例 808

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (12H, m), 2. 77 (6H, s), 2. 84 (3H, s), 3. 85 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H,

s), 5.52 (2H, s), 7.48 (1H, s), 7.56 (2H, s), 8.22 (1H, s), 8.57 (1H, s), 9.18 (1H, s), 9.85 (1H, s).

実施例 809

5 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.65-1.83 (4H, m), 2.05-2.19 (2H, m), 2.39 (2H, t, J=6.6Hz), 2.69 (2H, t, J=6.8Hz), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.00-4.19 (6H, m), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 612.3 (MH⁺)

実施例 810

15 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.17 (3H, t, J=7.0Hz), 1.28-1.44 (12H, m), 1.67-1.84 (4H, m), 2.06-2.17 (2H, m), 2.39 (2H, t, J=6.8Hz), 2.69 (2H, t, J=7.0Hz), 2.77 (3H, d, J=3.6Hz), 3.99-4.18 (6H, m), 4.24 (2H, t, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.56 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.47-8.58 (1H, m), 9.44 (1H, brs), 9.96 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 636.3 (MH⁺)

実施例 811

25 4-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=6.8Hz), 1.25-1.47 (12H, m), 1.88 (4H, brs), 1.98-2.10 (2H, m), 2.42-2.55 (2H, m), 2.77 (3H, brs), 3.11 (4H, brs), 3.65-3.88 (2H, m), 4.05 (2H, q, J=6.8Hz), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.87 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.50-8.58 (1H, m), 9.44 (1H, brs), 9.94 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 608.3 (MH⁺)

実施例 812

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;塩酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.16 (3H, t, J=7.0Hz), 1.26-1.45 (12H, m), 1.62-1.85 (4H, m), 1.88 (4H, brs), 2.37 (2H, t, J=6.8Hz), 2.77 (3H, brs), 3.12 (4H, brs), 3.78-3.91 (2H, m), 3.95-4.10 (2H, m), 4.12-4.32 (2H, m), 4.87 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.36 (1H, brs), 7.46 (1H, brs), 7.99 (1H, s), 8.53 (1H, q, J=4.4Hz) 9.35-9.46 (1H, m), 9.92-9.99 (1H, m).

15 MS:m/e (ESI) 622.3 (MH⁺)

実施例 813

ヘプタデカン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.83 (3H, t, J=7Hz), 1.15-1.28 (28H, m), 1.34 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7Hz), 1.61-1.70 (1H, m), 2.67 (2H, t, J=7Hz), 2.83 (3H, d, J=5Hz), 4.28 (2H, q, J=7Hz), 4.86 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.28 (1H, d, J=8Hz), 7.54 (1H, s), 7.93 (1H, d, J=8Hz), 7.98 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=5Hz), 8.57 (1H, s).

25 実施例 814

ヘプタデカン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ

-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.83 (3H, t, J=7Hz), 1.15-1.27 (28H, m), 1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.33 (9H, s), 1.38 (3H, t, J=7Hz), 1.39 (3H, t, J=7Hz), 1.60-1.70 (2H, m), 2.67 (2H, t, J=7Hz), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.20 (2H, q, J=7Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.28 (1H, d, J=8Hz), 7.32 (1H, s), 7.92 (1H, d, J=8Hz), 7.97 (1H, s).

実施例 815

酢酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.33 (3H, t, J=7Hz), 1.15-1.30 (28H, m), 1.62-1.70 (2H, m), 2.32 (3H, s), 2.58 (3H, s), 2.68 (3H, t, J=7Hz), 3.99 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.29 (1H, d, J=8Hz), 7.94 (1H, d, J=8Hz), 7.98 (1H, s).

15 実施例 816

2-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-5,6-ジエトキシ-2,3-ジヒドロ-イソインドール-1-オン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.45-1.52 (6H, m), 1.46 (9H, s), 4.10-4.19 (4H, m), 4.42 (2H, s), 5.00 (2H, s), 5.80 (1H, s), 6.91 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.90 (2H, s).

実施例 817

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.11 (4H, m), 2.02-2.08 (2H, m), 2.29-2.34 (1H, m), 3.08-3.13 (2H, m), 3.15-3.4

2 (2H, m), 3. 65 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 26 (1H, br), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, d, J=4. 8Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 45 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

実施例 818

- 5 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル オキシ)-酢酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 08-1. 10 (4H, m), 2. 01-2. 10 (2H, m), 2. 30-2. 33 (1H, m), 3. 11-3. 14 (2H, m), 3. 40-3. 44 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 65 (3H, m), 4. 17 (2H, s), 4. 26 (1H, br), 4. 82 (2H, s), 5. 56 (2H, d, J=4. 4Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 49 (1H, brs), 9. 66 (1H, brs).

実施例 819

- 15 {2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 24 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 32-1. 45 (12H, m), 1. 99-2. 12 (2H, m), 2. 66 (2H, t, J=7. 0Hz), 3. 98-4. 30 (8H, m), 4. 77 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 598. 3 (MH⁺)

実施例 820

- 25 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 65-1. 75 (2H, m), 1. 78-1. 87 (2H, m), 2. 23-2. 37 (3H, m), 3. 87 (3H, s), 3.

95 (H, s), 4.13 (2H, t, J=7Hz), 4.81 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.17 (1H, d, J=8Hz), 7.35 (1H, s), 7.83 (1H, d, J=2Hz), 7.88 (1H, dd, J=2Hz, 8Hz), 9.07 (1H, brs), 9.35 (1H, brs).

実施例 821

5 5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.05-1.14 (4H, m), 1.37 (9H, s), 1.65-1.75 (2H, m), 1.78-1.88 (2H, m), 2.25-2.37 (1H, m), 2.30 (2H, t, J=7Hz), 4.13 (2H, t, J=7Hz), 4.82 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.18 (1H, d, J=8 Hz), 7.72 (1H, d, J=8Hz), 7.84 (1H, s), 7.91 (1H, d, J=8Hz), 8.09 (1H, d, J=8Hz), 9.51 (1 H, brs), 9.65 (1H, brs).

実施例 822

15 5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.63-1.68 (2H, m), 1.78-1.82 (2H, m), 1.91-1.99 (1H, m), 2.03-2.12 (1H, m), 2.29 (2H, t, J=6.4Hz), 3.05-3.10 (2H, m), 3.23 (3H, s), 3.20-3.38 (2H, m), 3.73 (2H, q, J=4.4Hz), 3.86 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.04 (1H, brs), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.3 3 (1H, s), 7.36 (1H, s), 7.46 (1H, s), 9.07 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 600.3 (MH⁺)

実施例 823

25 5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 62-1. 71 (2H, m), 1. 76-1. 82 (2H, m), 1. 92-1. 98 (1H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 39 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 02-3. 12 (2H, m), 3. 23 (3H, s), 3. 26-3. 34 (2H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 71-3. 76 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 01-4. 07 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 9. 08 (1H, s), 9. 33 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 614. 3 (MH⁺)

実施例 824

5-{2-第3 ブチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;トリフルオロ酢酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, t, J=6. 4Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 68-1. 70 (2H, m), 1. 76-1. 84 (2H, m), 1. 88-1. 98 (1H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 28 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 04-3. 12 (2H, m), 3. 26-3. 47 (3H, m), 3. 78 (2H, q, J=6. 4Hz), 3. 87 (3H, s), 3. 89-3. 90 (2H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 14 (1H, brs), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 628. 4 (MH⁺)

実施例 825

5-{2-第3 ブチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 メチルエステル;塩酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 09 (3H, t, J=6. 7Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 68-1. 71 (2H, m), 1. 74-1. 82 (2H, m), 1. 88-1. 98 (1H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 39 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 03-3. 11 (2H, m), 3. 24-3. 38 (2H, m), 3. 77-3. 80 (2H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 88-3. 92 (2H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 11-4. 15 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 9. 09 (1H, s), 9. 37 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 628. 3 (MH⁺)

実施例 826

5 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 68-1. 72 (2H, m), 1. 77-1. 85 (2H, m), 2. 18-2. 21 (1H, m), 2. 40 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 08-3. 12 (1H, m), 3. 24-3. 38 (3H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 85 (3H, s), 3. 86-3. 92 (3H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 93 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 609. 3 (MH⁺)

実施例 827

15 3-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジルオキシ}-4-シアノ-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 16 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 31 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 65 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 75-3. 06 (6H, m), 4. 08 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 67 (2H, dd, J=11. 6Hz, 11. 6Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 72 (1H, s), 7. 77 (1H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 23 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

実施例 828

25 4-{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 91 (6H, t, J=6. 8Hz), 1. 21 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 32 (9H, s), 2. 02-2. 13 (2H, m), 2. 48 (2H

, t, J=7.6Hz), 3.04-3.19 (4H, m), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 4.06-4.17 (4H, m), 4.72 (2H, s), 5.65 (2H, s), 6.83 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.59 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 586.3 (MH⁺)

実施例 829

- 5 4-{2-第3ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酪酸 エチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 0.93 (6H, br), 1.17 (3H, br), 1.35 (12H, br), 2.01 (2H, br), 2.42-2.56 (2H, br), 2.76 (3H, br), 3.60-4.48 (6H, m), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.48 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.90 (1H, s), 8.53 (1H, br), 9.42 (1H, s), 9.94 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 610.4 (MH⁺)

実施例 830

- 15 2-{2-[3-第3ブチル-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.36 (9H, s), 1.43 (3H, t, J=6.8Hz), 2.85 (3H, d, J=4.0Hz), 3.02 (3H, s), 3.32 (3H, s), 4.30 (2H, q, J=6.8Hz), 4.89 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.57 (1H, s), 7.79 (1H, s), 7.84 (1H, s), 7.93 (1H, s), 8.23 (1H, q, J=4.0Hz), 8.58 (1H, s), 9.25 (1H, s), 9.89 (1H, s).

実施例 831

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(ジメタンスルフォニル-アミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.37 (9H, s), 1.44 (3H, t, J=6.4Hz), 2.84 (3H, s), 3.61 (6H, s), 4.30 (2H, q, J=6.4Hz), 4

. 90 (2H, s), 5. 58 (2H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 87 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 22 (1H, s), 8. 59 (1H, s), 9. 28 (1H, s), 9. 88 (1H, s).

実施例 832

5 1-(7-第 3 ブチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 32 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 50 (9H, s), 4. 14 (2H, d, J=7. 2Hz), 4. 24 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 62 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 92 (1H, s), 8. 44 (1H, s), 8. 98 (1H, s), 9. 11 (1H, s), 9. 40 (1H, s).

10 実施例 833

1-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-2,5-ジオン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 27 (9H, s), 2. 74-2. 95 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 37 (1H, s), 7. 94 (1H, dd, J=8. 0, 2. 0Hz), 8. 10 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 834

20 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 10-1. 23 (4H, m), 1. 74-2. 10 (2H, m), 2. 27-2. 35 (1H, m), 2. 43 (1H, t, J=7. 2Hz), 3. 42 (1H, dd, J=7. 2, 6. 0Hz), 3. 90 (1H, ddd, J=7. 2, 5. 6, 1. 6Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 5. 45 (1H, dd, 6. 0, 1. 6Hz), 6. 81 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 66 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 83 (1H, dd, J=8. 4, 2. 0Hz), 7. 93 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 99 (1H, d, J=8. 4Hz).

実施例 835

4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 36 (9H, s), 1. 75-1. 84 (2H, m), 2. 25-2. 31 (2H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 86 ((3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 78 (2H, s), 5. 35 (2H, s), 5. 70-5. 78 (1H, m), 6. 75 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 74 (1H, s), 9. 00-9. 07 (1H, m), 9. 28-9. 32 (1H, m).

実施例 836

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;塩酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 38 (9H, s), 1. 61-1. 70 (2H, m), 1. 76-1. 84 (2H, m), 2. 12-2. 22 (1H, m), 2. 28 (2H, t, J=6. 8Hz), 2. 36-2. 41 (1H, m), 3. 02-3. 10 (1H, m), 3. 25-3. 29 (1H, m), 3. 42-3. 49 (1H, m), 3. 61-3. 70 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 01-4. 08 (2H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 40 (1H, brd, J=56Hz), 5. 55 (2H, d, J=4. 4Hz), 7. 36 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 9. 10 (1H, br), 9. 45 (1H, br).

MS:m/e (ESI) 588. 3 (MH⁺)

実施例 837

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸 メチルエステル;塩酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 38 (9H, s), 1. 61-1. 72 (2H, m), 1. 75-1. 84 (2H, m), 2. 08-2. 22 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=6. 8Hz), 3. 02-3. 10 (1H, m), 3. 25-3. 28 (1H, m), 3. 42-3. 50 (1H, m), 3. 58 (3H, s), 3. 64-3. 68 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 40-4. 42 (2H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 40 (1H, brd, J=56Hz), 5. 59 (2H, d, J=4. 0Hz), 7. 36 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 9. 12 (1H, brs), 9

. 51 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 602. 3 (MH⁺)

実施例 838

5 3-{3-第3ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジルオキシ}-4-シアノ-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 59-3. 11 (8H, m), 4. 29 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 68 (2H, dd, J=12. 0Hz, 12. 0Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 7. 79 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 23 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 839

15 5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 66-1. 88 (4H, m), 2. 25-2. 42 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 05 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 14 (2H, t, J=7. 0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 17 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 83 (1H, s), 7. 90 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 840

20 5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシメチル}-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-カルボン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 38 (9H, s), 1. 85-1. 90 (4H, m), 3. 06-3. 14 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 92-3. 99 (1H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 06-4. 10 (1H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 16-5. 22 (1H, m), 5. 58 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 40 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 9. 11 (1H, s), 9. 51 (1H, s).

実施例 841

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(ピロリジン-1-イル)-フェノキシメチル}-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-カルボン酸 メチルエステル;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.38 (9H, s), 1.84-1.91 (4H, m), 3.06-3.18 (4H, m), 3.78 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.96-4.00 (1H, m), 3.95 (3H, s), 4.09 (1H, dd, $J=7.2, 10.4\text{Hz}$), 4.79 (2H, s), 5.17-5.26 (1H, m), 5.55 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.48 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.10 (1H, s), 9.45 (1H, s).

10 実施例 842

6-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1.22-1.58 (12H, m), 2.83 (3H, brs), 4.20-4.46 (2H, m), 4.88 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.17-7.48 (2H, m), 7.55 (1H, s), 7.85-7.99 (1H, m), 8.03 (1H, s), 8.15-8.26 (1H, m), 8.29-8.41 (1H, m), 8.57 (1H, s), 8.66 (1H, brs), 9.18-9.27 (1H, m), 9.79-9.97 (2H, m).

実施例 843

20 6-{2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸メチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1.34 (9H, s), 1.42 (3H, t, $J=7.2$), 2.83 (3H, d, $J=4.4$), 3.85 (3H, s), 4.15-4.42 (2H, m), 4.88 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.15-7.35 (2H, m), 7.55 (1H, s), 7.95 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8.04 (1H, s), 8.13-8.28 (1H, m), 8.39 (1H, dd, $J=8.4$ and 2.4Hz), 8.57 (1H, s), 8.69 (1H, brs), 9.17-9.29 (1H, m), 9.80-9.92 (2H, m).

実施例 844

5-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.14-1.18 (4H, m), 1.21-1.25 (2H, m), 1.38 (9H, s), 1.94-2.03 (2H, m), 2.09-2.21 (3H, m), 2.43 (2H, br. t, $J=6\text{Hz}$), 2.71-2.80 (1H, brs), 2.96-3.07 (2H, brs), 3.28-3.37 (2H, brs), 3.69 (3H, s), 3.70 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 4.21-4.26 (2H, brs), 4.88 (2H, s), 6.40 (2H, s), 7.65 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.77-7.82 (3H, m).

10 実施例 845

5-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸 メチルエステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1.20 (2H, m), 1.38 (9H, s), 1.84-1.92 (2H, m), 2.06-2.16 (2H, m), 2.44 (2H, br. t, $J=6\text{Hz}$), 2.70-2.79 (2H, 1H, brs), 2.95-3.06 (2H, brs), 3.26-3.37 (2H, brs), 3.69 (3H, s), 3.69 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 3.96 (3H, s), 3.98 (3H, s), 4.20-4.24 (2H, m), 4.85 (2H, s), 6.09 (2H, s), 6.92 (1H, s), 7.76 (2H, s).

実施例 846

20 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 0.97 (3H, d, $J=5.2\text{Hz}$), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.48-2.22 (4H, m), 2.70-2.91 (1H, m), 2.82 (3H, d, $J=3.2\text{Hz}$), 3.68-3.80 (1H, m), 3.85 (1H, d, $J=15.2\text{Hz}$), 4.27 (2H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 4.83 (2H, s), 5.03 (1H, d, $J=15.2\text{Hz}$), 5.44 (1H, d, $J=18.8\text{Hz}$), 5.52 (1H, d,

J=18.8Hz), 7.43 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.12-8.30 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.14 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

実施例 847

5 [2-第3ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸 エチルエステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.97 (3H, d, J=5.6Hz), 1.22 (3H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.46-1.58 (1H, m), 1.65-1.80 (1H, m), 1.81-1.94 (1H, m), 2.08-2.22 (1H, m), 2.68-2.80 (1H, m), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 3.40-3.58 (1H, m), 3.65-3.79 (1H, m), 4.00 (1H, d, J=15.6Hz), 4.10-4.35 (4H, m), 4.84 (2H, s), 5.07 (1H, d, J=15.6Hz), 5.45 (1H, d, J=19.2Hz), 5.53 (1H, d, J=19.2Hz), 7.45 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.20 (1H, brs), 8.55 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

実施例 848

15 2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第3ブチル-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.34 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.81 (3H, brs), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.29 (3H, s), 4.29 (2H, q, J=7.2Hz), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.65-7.98 (3H, m), 8.12-8.27 (1H, m), 8.57 (1H, s), 9.22 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

実施例 849

25 6-[2-(8-第3ブチル-4-メタンсульフォニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28-1. 46 (12H, m), 1. 81 (3H, brs), 2. 77 (3H, d, J=3. 6Hz), 3. 18 (3H, s), 3. 86 (2H, brs), 4. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 45 (2H, brs), 4. 88 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 66 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 14 (1H, s), 8. 43-8. 61 (1H, m), 9. 34-9. 48 (1H, m), 9. 87-10. 01 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 544. 2 (MH⁺)

5 実施例 850

5-{2-第3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 18 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 68-1. 82 (4H, m), 2. 39 (2H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 94-3. 02 (4H, m), 3. 76-3. 83 (4H, m), 4. 04 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 24 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 0Hz), 8. 57 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

15 実施例 851

5-{2-第3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェノキシ}-ペンタン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 17 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 70-1. 84 (4H, m), 2. 37-2. 44 (2H, m), 2. 96-3. 03 (4H, m), 3. 75-3. 92 (4H, m), 3. 97 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 04 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 24 (2H, t, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 62 (1H, s).

実施例 852

- 25 (1-{3-第3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 99-2. 12 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=3. 6Hz), 3. 06-3. 16 (2H, m), 3. 64 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 16-4. 35 (3H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 48 (2H, brs), 7. 35 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 13-8. 24 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 10-9. 18 (1H, m), 9. 79-9. 89 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 581. 3 (MH⁺)

実施例 853

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24-1. 54 (12H, m), 1. 98-2. 14 (2H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 06-3. 15 (2H, m), 3. 64 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 13-4. 42 (2H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 53 (2H, brs), 7. 34 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 42-8. 62 (1H, m), 9. 32-9. 45 (1H, m), 9. 90-10. 00 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 582. 3 (MH⁺)

実施例 854

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸 メチルエステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 98-2. 13 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 06-3. 15 (2H, m), 3. 38-3. 48 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 64 (3H, s), 4. 17 (2H, s), 4. 18-4. 40 (3H, m), 4. 84 (2H, s), 5. 40-5. 56 (2H, m), 7. 34 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 44 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 8. 11-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 12-9. 18 (1H, m), 9. 79-9. 86 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 595. 3 (MH⁺)

実施例 855

メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバ
モイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.35 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.70 (3H, d, J=4.4Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 4.28
(2H, q, J=6.8Hz), 4.86 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.26 (1H, d, J=8.4Hz), 7.54 (1H, s), 7.86-
7.93 (3H, m), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481.1 (MH⁺)

実施例 856

- 10 メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水
素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.35 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.70 (3H, d, J=4.8Hz), 4.11
(2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), , 4.80 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.25 (1H, d, J=8.8
Hz), 7.33 (1H, s), 7.88-7.92 (3H, m).

MS:m/e (ESI) 486.2 (MH⁺)

実施例 857

- 20 メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバ
モイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エ
ステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.35 (9H, s), 1.36 (3H, t, J=7.0Hz), 2.70 (3H, d, J=4.6Hz), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 4.24
(2H, q, J=7.0Hz), 4.90 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.26 (1H, d, J=8.4Hz), 7.87-7.94 (3H, m),
8.00 (1H, s), 8.53 (1H, q, J=4.6Hz), 9.43 (1H, brs), 9.96 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 482.1 (MH⁺)

実施例 858

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-イル}-酢酸;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 28 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 32 (9H, s), 1. 40 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2. 56 (1H, dd, $J=16.8, 8.2\text{Hz}$), 2. 77 (1H, dd, $J=16.8, 4.0\text{Hz}$), 2. 92 (3H, s), 3. 08 (1H, dd, $J=16.4, 8.0\text{Hz}$), 3. 62-3. 72 (1H, m), 4. 12 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 7. 22 (2H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 58-4. 64 (1H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 18 (1H, s), 7. 24 (1H, s).

10 実施例 859

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-イル}-酢酸;塩酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1. 34 (9H, s), 2. 54 (1H, dd, $J=16.8, 8.2\text{Hz}$), 2. 74 (1H, dd, $J=16.8, 4.4\text{Hz}$), 2. 94 (3H, s), 3. 08 (1H, dd, $J=16.4, 8.0\text{Hz}$), 3. 60-3. 72 (1H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 97 (3H, s), 4. 57-4. 64 (1H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 18 (1H, s), 7. 27 (1H, s), 7. 36 (1H, s).

実施例 860

20 {8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒド
ロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベン
ゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;塩酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 29 (9H, s), 1. 36 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 2. 50-2. 62 (1H, m), 2. 75-2. 82 (1H, m), 2. 78 (3H, d, $J=4.0\text{Hz}$), 2. 92 (3H, s), 3. 04-3. 12 (1H, m), 3. 62-3. 74 (1H, m), 4. 24 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4. 58-4. 64 (1H, m), 4. 88 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 19 (1H, s), 7. 30 (1H, s), 7. 98 (1H, s), 8. 56 (1H, q, $J=4.0\text{Hz}$), 9. 94 (1H, brs).

実施例 861

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 20 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 29 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 30 (9H, s), 1. 39 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2. 62 (1H, dd, $J=16.0, 8.8\text{Hz}$), 2. 88 (1H, dd, $J=16, 3.6\text{Hz}$), 2. 90 (3H, s), 3. 08 (1H, dd, $J=12, 8.0\text{Hz}$), 3. 38 (1H, dd, $J=12, 3.6\text{Hz}$), 4. 08 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 10 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 21 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 60-4. 66 (1H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 19 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 34 (1H, s), 9. 03 (1H, brs), 9. 36 (1H, brs).

実施例 862

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

15 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 20 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 30 (9H, t), 2. 62 (1H, dd, $J=16, 9.2\text{Hz}$), 2. 86 (1H, dd, $J=16, 3.2\text{Hz}$), 2. 90 (3H, s), 3. 08 (1H, dd, $J=12, 8.0\text{Hz}$), 3. 40 (1H, dd, $J=12, 2.4\text{Hz}$), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 11 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 60-4. 68 (1H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 18 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 28 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7. 35 (1H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

20 実施例 863

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 20 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 29 (9H, s), 1. 37 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2. 62 (1H, dd, $J=19.2, 8.8\text{Hz}$), 2. 77 (3H, d, $J=4.0\text{Hz}$), 2. 86 (1H, dd, $J=19.2, 3.2\text{Hz}$), 2. 91 (3H, s), 3. 09 (1H, dd, $J=12$

, 8. 8Hz), 3. 40 (1H, dd, J=12, 3. 6Hz), 4. 09 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 57-4. 70 (1H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 29 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 55 (1H, q, J=4. 0Hz), 9. 51 (1H, brs), 9. 96 (1H, brs).

実施例 864

- 5 2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 0. 92 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 61-1. 83 (2H, m), 2. 10-2. 24 (2H, m), 3. 09-3. 17 (1H, m), 3. 19-3. 26 (1H, m), 3. 41-3. 56 (2H, m), 3. 74 (3H, s), 3. 92 (1H, dd, J=7. 6and4. 8Hz), 3. 94 (3H, s), 4. 02 (3H, s), 4. 25-4. 33 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 46 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 60 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 865

- 15 2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酪酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 00 (3H, t, J=7. 6Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 63-1. 87 (2H, m), 2. 04-2. 19 (2H, m), 3. 13-3. 22 (1H, m), 3. 22-3. 30 (1H, m), 3. 40-3. 57 (2H, m), 3. 74 (3H, s), 3. 94 (3H, s), 3. 98 (1H, dd, J=7. 6and4. 4Hz), 4. 02 (3H, s), 4. 25-4. 35 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 46 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 60 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 866

- 25 8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-カルボン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 17 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 28 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (9H, s), 1. 27-1. 44 (3H, m), 2. 91 (3H, s), 3. 42-3. 55 (2H, m), 4. 12 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 10-4. 20 (2H, m), 4. 22 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 28-5. 32 (1H, m), 5. 47 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 32-7. 36 (2H, m), 9. 03 (1H, brs), 9. 34 (1H, brs).

5 実施例 867

2-(3, 5-ジ第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-ベンゾイルアミノ)-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩
 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 41 (21H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 99 (2H, s), 7. 47 (1H, s),
 10 7. 77 (2H, s), 8. 20 (1H, q, 4. 8Hz), 8. 52 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH⁺)

実施例 868

1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水
 15 素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 75 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 06 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

20 実施例 869

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

25 1. 37 (9H, s), 2. 75 (6H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 0Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 45 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 06 (1H,), 8. 36 (1H, q, J=4. 0H

z), 8.93 (1H, brs), 9.49 (1H, brs).

実施例 870

5 6-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 2.76 (6H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 3.83 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.60 (2H, s), 7.48 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.00 (1H, s), 8.57 (1H, q, J=4.0Hz), 9.56 (1H, brs), 9.97 (1H, brs).

10 実施例 871

{8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-3-オキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.81 (1H, dd, J=16.8, 8.0Hz), 3.05 (1H, dd, J=16.8, 4.0Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 4.98 (1H, d, J=4.0Hz), 5.45 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.41 (1H, d, J=2.0Hz), 7.53 (1H, d, J=2.0Hz), 9.03 (1H, brs), 10.97 (1H, brs).

実施例 872

20 {8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-3-オキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.17 (3H, t, J=7.2Hz), 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.92 (1H, dd, J=16Hz, 8.0Hz), 3.14 (1H, dd, J=16Hz, 4.0Hz), 4.04-4.17 (4H, m), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.04 (1H, dd, J=8.0Hz, 4.0Hz), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.41

(1H, s), 7.52 (1H, s), 9.05 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 570.2 (MH⁺)

実施例 873

5 2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル
オキシ)-酪酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.83 and 0.87 [3H (1:1). each t. each
 J=7.2 Hz], 1.10-1.28 (3H, m), 1.38 (9H, s), 1.49-1.75 (2H, m), 1.92-2.17 (2H, m), 2.99
 10 -3.20 (2H, m), 3.25-3.52 (2H, m), 3.64 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.02-4.29 (3
 H, m), 4.81 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.37 (1H, s), 7.44 (1H, s), 9.02-9.13 (1H
 , m), 9.26-9.39 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 614.3 (MH⁺)

実施例 874

15 1-(3-第3ブチル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8 Hz), 1.33 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8 Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8 Hz), 4.21
 (2H, q, J=6.8 Hz), 4.82 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.55 (1H, t, J=8.0 Hz), 7.78 (
 20 1H, d, J=8.0 Hz), 7.83 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.97 (1H, s), 9.05 (1H, brs), 9.35 (1H, brs).

実施例 875

2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジ
メチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチル
アミド;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8 Hz), 2.77 (3H, d, J=4.4 Hz), 2.92 (6H, s), 3.89 (3H, s), 4

. 13 (2H, q, J=6.8Hz), 4.74 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.51 (2H, d, J=7.6Hz), 8.07 (1H, s), 8.35-8.38 (1H, m), 8.94 (1H, brs), 9.54 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481.2 (MH⁺)

実施例 876

- 5 2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.36 (9H, s), 1.39-1.43 (6H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.89 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.85 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.51-7.54 (3H, m), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 482.2 (MH⁺)

実施例 877

- 15 1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.38-1.43 (6H, m), 3.89 (3H, s), 4.08-4.24 (6H, m), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.51 (2H, d, J=5.2Hz), 9.03 (1H, brs), 9.26 (1H, brs).

- 20 MS:m/e (ESI) 487.2 (MH⁺)

実施例 878

- 6-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 1.40-1.43 (6H, m), 2.78 (3H, d, J=4.8Hz), 3.90 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0

Hz), 4.24 (2H, q, J=7.0Hz), 4.89 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.50-7.52 (2H, m), 8.00 (1H, s), 8.53 (1H, m), 9.42 (1H, brs), 9.96 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 483.1 (MH⁺)

実施例 879

- 5 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.62-1.77 (2H, m), 1.96-2.10 (2H, m), 2.68-2.90 (5H, m), 3.12-3.59 (3H, m), 3.94 (3H, s), 4.08 (2H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.83 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.14-8.27 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.09-9.17 (1H, m), 9.78-9.88 (1H, m).

実施例 880

- 15 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.36 (9H, s), 1.63-1.76 (2H, m), 1.97-2.08 (2H, m), 2.69-2.82 (2H, m), 3.16-3.60 (3H, m), 3.87 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.07 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.06-9.10 (1H, m), 9.24-9.32 (1H, m).

実施例 881

- (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.19 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.64-1.78 (2H, m), 1.97-2.

10 (2H, m), 2.69–2.80 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8 Hz), 3.18–3.30 (2H, m), 3.49–3.60 (1H, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.16 (2H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.14–8.30 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.09–9.22 (1H, m), 9.77–9.91 (1H, m).

5 MS:m/e (ESI) 623.2 (MH⁺)

実施例 882

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.19 (3H, t, J=7.2 Hz), 1.36 (9H, s), 1.62–1.78 (2H, m), 1.97–2.10 (2H, m), 2.69–2.84 (2H, m), 3.17–3.32 (2H, m), 3.50–3.58 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.17 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.06–9.12 (1H, m), 9.24–9.35 (1H, m).

15 MS:m/e (ESI) 600.2 (MH⁺)

実施例 883

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.38–1.41 (12H, m), 3.68 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.70 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.95–8.10 (2H, m), 9.02 (1H, brs), 9.31 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 507.1 (MH⁺)

25 実施例 884

{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 37 (9H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 34 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 7. 70 (1H, s), 9. 10 (1H, brs), 9. 37 (1H, brs).

実施例 885

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニトリル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 07-2. 16 (2H, m), 2. 67-2. 75 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 90 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 11-4. 18 (2H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 49-7. 59 (2H, m), 9. 00-9. 17 (1H, brs), 9. 27-9. 40 (1H, m).

実施例 886

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 37 (9H, s), 2. 73-2. 82 (3H, m), 2. 91 (6H, s), 3. 89 (3H, s), 4. 78 (2H, s), 5. 33 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 31-8. 46 (1H, m), 8. 97 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

実施例 887

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 06-2. 17 (2H, m), 2. 71 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 89 (3H, s), 4. 24 (2H, t, J=6. 0Hz), 4. 74 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 33-8. 41 (1H, m), 8. 95 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

実施例 888

- 5 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 36-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 28 (2H, q, J=7Hz), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 85 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 42-7. 45 (2H, m), 7. 53 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 504. 3 (MH⁺)

実施例 889

- 15 6-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 33-1. 38 (12H, s), 2. 78 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 25 (2H, q, J=7Hz), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 89 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 40-7. 43 (2H, m), 7. 99 (1H, s), 8. 53 (1H, q, J=5Hz), 9. 46 (1H, brs), 9. 93 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 505. 3 (MH⁺)

実施例 890

- 25 {8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 40-7. 42 (2H, m), 9. 06 (1H, brs), 9. 35 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH+)

5 実施例 891

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 33-1. 42 (12H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 21 (2H, q, J=7Hz), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 40-7. 42 (2H, m), 9. 03 (1H, brs), 9. 34 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 509. 3 (MH+)

実施例 892

15 {8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 06-1. 11 (4H, m), 1. 36 (9H, s), 2. 32 (1H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 41-7. 44 (2H, m), 7. 72 (1H, d, J=8Hz), 8. 09 (1H, d, J=8Hz), 9. 52, (1H, brs), 9. 64 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 444. 3 (MH+)

実施例 893

25 2-[2-(8-第3ブチル-4-シアノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 40 (2H, m), 4. 66 (2H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 41-7. 43 (2H, m), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4Hz), 8. 98 (1H, brs), 9. 53 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 503. 4 (MH⁺)

実施例 894

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 29 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 34 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 65 (1H, s), 7. 71 (1H, s), 8. 15-8. 30 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 14-9. 26 (1H, m), 9. 77-9. 93 (1H, m).

実施例 895

15 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-シアノプロポキシ)-4-メトキシフェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 06-2. 17 (2H, m), 2. 72 (2H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 90 (3H, s), 4. 15 (2H, t, J=6. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 49-7. 62 (3H, m), 8. 15-8. 26 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 18 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 896

25 2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシベンゾイルアミノ)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (9H, s), 1. 41 (3H, t, 6. 8Hz), 2. 74 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 80 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=6. 8Hz), 5. 00 (2H, s), 7. 5-7. 6 (3H, m), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz) 8. 60 (1H, s), 9. 75 (1H, s), 10. 30 (1H, s), 11. 53 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 482. 1 (MH⁺)

実施例 897

{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 37 (9H, s), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 79 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 31-7. 35 (2H, m), 7. 88 (1Hs), 7. 97-7. 99 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 440. 1 (MH⁺)

実施例 898

{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 08-1. 11 (4H, m), 1. 37 (9H, S), 2. 30-2. 34 (1H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 42 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 72 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 89 (1H, s), 8. 00 (1H, d, J=8. 8Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 2Hz), 9. 60 (2H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 403. 0 (MH⁺)

実施例 899

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, S), 1. 42 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 86

(2H, s), 5.41 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.6Hz), 7.54 (1H, s), 7.89 (1H, s), 8.00 (1H, d, J=8.6Hz), 8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.19 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 463.1 (MH⁺)

実施例 900

- 5 1-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 3.87 (3H, s), 3.89 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0Hz), 4.81 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.51 (1H, s), 9.03 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 459.1 (MH⁺)

実施例 901

- 15 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-5-エトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.38 (9H, s), 1.45 (3H, t, J=7.2Hz), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 2.92 (6H, s), 4.19 (2H, q, J=7.2Hz), 4.74 (2H, s), 5.19 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.55 (2H, s), 8.07 (1H, s), 8.36 (1H, q, J=4.6Hz), 8.95 (1H, brs), 9.53 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 506.2 (MH⁺)

実施例 902

- 25 {2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, S), 1. 45 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 19 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 19 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 54 (2H, d, J=1. 2Hz), 9. 08 (1H, br s), 9. 33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 484. 1 (MH+)

5 実施例 903

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 37 (9H, S), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92 (6H, s), 4. 75 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 89 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 95 (1H, brs), 9. 53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 462. 1 (MH+)

実施例 904

15 {2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 4. 12 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 7. 88 (1H, s), 7. 98 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 02 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 468. 1 (MH+)

実施例 905

{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, S), 2. 67 (3H, s), 4. 87 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 33 (1H, d, J=8. 4Hz)

), 7.71 (1H, d, J=8.4Hz), 7.89 (1H, d, J=2.0Hz), 8.00 (1H, dd, J=2.0, 8.4Hz), 8.16 (1H, d, J=8.4Hz), 9.50 (1H, brs), 9.97 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 377.0 (MH⁺)

実施例 906

- 5 {2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.31 (3H, t, J=7.6Hz), 1.37 (9H, s), 2.95 (2H, q, J=7.6Hz), 4.87 (2H, s), 5.41 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.8Hz), 7.74 (1H, d, J=8.0Hz), 7.90 (1H, s), 8.01 (1H, d, J=8.4Hz), 8.18 (1H, d, J=8.0Hz), 9.52 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 391.0 (MH⁺)

実施例 907

- 15 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 2.94-3.04 (4H, m), 3.70-3.86 (4H, m), 3.95 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.50 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.61 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.56 (1H, s), 9.16 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 524.2 (MH⁺)

実施例 908

- 25 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 2. 95-3. 05 (4H, m), 3. 74-3. 85 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 60 (1H, s).

実施例 909

5 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノフェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 08-1. 15 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 28-2. 36 (1H, m), 2. 94-3. 06 (4H, m), 3. 75-3. 86 (4H, m), 3. 95 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 10 (1H, d, J=8. 0Hz).

実施例 910

{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 33 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 7. 69 (1H, s), 9. 00-9. 10 (1H, m), 9. 29-9. 37 (1H, m).

実施例 911

20 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 07-2. 17 (2H, m), 2. 72 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 90 (3H, s), 4. 07-4. 17 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 96-9. 09 (1H, m), 9. 23-9. 36 (1H, m)

実施例 912

{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水
5 素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.05-1.16 (4H, m), 1.37 (9H, s), 2.27-2.37 (1H, m), 3.89 (3H, s), 4.84 (2H, s), 5.33 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.65 (1H, s), 7.70 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.51 (1H, brs), 9.67 (1H, brs).

10 実施例 913

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニトリル;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.05-1.18 (4H, m), 1.36 (9H, s), 2.07-2.18 (2H, m), 2.28-2.38 (1H, m), 2.72 (2H, t, J=7.2Hz), 3.89 (3H, s), 4.15 (2H, t, J=6.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.55 (2H, brs), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.04-9.55 (2H, m).

実施例 914

1-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素
20 酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.03-1.17 (4H, m), 1.33 (6H, d, J=6.0Hz), 1.35 (9H, s), 2.25-2.37 (1H, m), 3.88 (3H, s), 4.65-4.79 (1H, m), 4.82 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.51 (2H, s), 7.72 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.46-9.73 (2H, m).

実施例 915

1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 74 (6H, s), 3. 82 (3H, s), 4. 14 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 32 (1H, s), 7. 45 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 486. 2 (MH⁺)

実施例 916

- 10 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 95-3. 12 (4H, m), 3. 75-3. 84 (4H, m), 3. 94 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 59 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 917

- 20 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 40-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 68 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 70 (1H, d, J=8. 4Hz), 7. 97-8. 00 (2H, m), 8. 19-8. 22 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 20 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 502. 1 (MH⁺)

実施例 918

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 40 (9H, s), 2. 77 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 2. 92 (6H, s), 3. 68 (3H, s), 4. 76 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 70 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7. 95-8. 00 (2H, m), 8. 07 (1H, s), 8. 34-8. 37 (1H, m), 8. 96 (1H, brs), 9. 57 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 501. 1 (MH $^+$)

10 実施例 919

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1. 36 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1. 41 (9H, s), 2. 77 (3H, d, $J=4.4\text{Hz}$), 3. 68 (3H, s), 4. 24 (2H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4. 90 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 70 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7. 95-8. 00 (3H, m), 8. 52 (1H, m), 9. 44 (1H, brs), 9. 99 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 503. 1 (MH $^+$)

実施例 920

20 2-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1. 15 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 33-1. 48 (12H, m), 3. 30-3. 40 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 10. (2H, m), 4. 40 (2H, m), 4. 71 (1H, q, $J=6\text{Hz}$), 4. 79 (2H, s), 5. 40 (1H, d, $J=18\text{Hz}$), 5. 50 (1H, d, $J=18\text{Hz}$), 7. 18 (1H, brs), 7. 27 (1H, brs), 7. 35 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 38 (1H

, brs).

実施例 921

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-
 5 イル}-プロパン酸 エチルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.03-1.12 (4H, m), 1.15 (3H, t, J=7Hz), 1.35 (9H, s), 1.44 (3H, d, J=6Hz), 2.32 (1H, m),
 3.30-3.40 (2H, m), 4.09 (2H, m), 4.25-4.30 (2H, m), 4.28 (2H, m), 4.71 (1H, q, J=6Hz), 4
 .80 (2H, s), 5.43 (1H, d, J=18Hz), 5.52 (1H, d, J=18Hz), 7.20 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.71
 10 (1H, d, J=8Hz), 8.08 (1H, d, J=8Hz), 9.50 (1H, brs), 9.62 (1H, brs).

実施例 922

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-オキソ-
エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.39 (9H, s), 2.71 (6H, s), 2.77 (3H, d, J=4.4Hz), 2.91 (6H, s), 4.74 (2H, s), 5.25 (2H, s
), 5.46 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.60 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.35 (1H, m), 8.92
 (1H, brs), 9.53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 505.2 (MH⁺)

実施例 923

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-オキソ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.91 (4H, brs), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 3.15 (4H, br
 s), 3.64 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=7.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.43 (1

H, s), 7.53 (1H, s), 8.18-8.21 (1H, m), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 507.2 (MH⁺)

実施例 924

5 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.91 (4H, brs), 3.15 (4H, brs), 3.64 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.42 (1H, s), 9.01 (1H, brs), 9.23 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 512.2 (MH⁺)

実施例 925

15 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.91 (4H, brs), 2.78 (3H, d, J=4.4Hz), 2.91 (6H, s), 3.15 (4H, brs), 3.64 (3H, s), 4.72 (2H, s), 5.42 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.43 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.35-8.38 (1H, m).

20 MS:m/e (ESI) 506.3 (MH⁺)

実施例 926

25 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.11 (4H, m), 1.38 (9H, s), 1.91 (4H, brs), 2.29-2.35 (1H, m), 3.15 (4H, brs), 3.6

5 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=8. 6Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 6Hz), 9. 50 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

実施例 927

5 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(ピロリジン-1-イル)-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 91 (4H, brs), 3. 15 (4H, brs), 3. 65 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 43 (1H, s), 9. 02 (1H, brs), 9. 23 (1
10 H, brs).

MS:m/e (ESI) 484. 2 (MH⁺)

実施例 928

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 33 (6H, d, J=6. 4Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 88 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 64-4. 77 (1H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 12-9. 21 (1H, m), 9. 79-9. 89 (1H, m)
20 .

実施例 929

1-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 33 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 35 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 88

(3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 64-4. 77 (1H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 50 (2H, s), 9. 05 (1H, brs), 9. 29 (1H, brs).

実施例 930

5 1-(3-第3ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 33 (6H, d, J=5. 6Hz), 1. 35 (9H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 88 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 64-4. 76 (1H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 50 (2H, s), 8. 99-9. 16 (1H, m), 9. 25-10 9. 40 (1H, m).

実施例 931

2-{8-第3ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;塩酸塩

15 1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 15 (3H, t, J=7Hz), 1. 30-1. 50 (15H, m), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 09 (2H, m), 4. 22-4. 36 (4H, m), 4. 71 (1H, q, J=6Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 38 (1H, d, J=18Hz), 5. 48 (1H, d, J=18Hz), 7. 20 (1H, brs), 7. 28 (1H, brs), 7. 53 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

20 実施例 932

2-{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

25 1. 15 (3H, t, J=7Hz), 1. 32-1. 39 (12H, m), 1. 44 (3H, d, J=7Hz), 2. 33 (1H, m), 2. 77 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 09 (2H, m), 4. 20-4. 30 (4H, m), 4. 71 (1H, q, J=7Hz), 4. 86 (

2H, s), 4.82 (2H, s), 5.43 (1H, d, J=18Hz), 5.52 (1H, d, J=18Hz), 7.20 (1H, d, J=2Hz), 7.27 (1H, d, J=2Hz), 7.98 (1H, s), 8.55 (1H, q, J=5Hz), 9.47 (1H, brs), 9.92 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 566.2 (MH⁺)

実施例 933

- 5 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロパン酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.15 (3H, t, J=7Hz), 1.32-1.39 (9H, m), 1.44 (3H, d, J=7Hz), 2.77 (3H, d, J=5Hz), 3.30-3.40 (2H, m), 4.10 (2H, m), 4.27 (2H, m), 4.70-4.73 (3H, m), 5.35 (1H, d, J=18Hz), 5.46 (1H, d, J=18Hz), 7.14 (1H, s), 7.21 (1H, d, J=2Hz), 7.27 (1H, d, J=2Hz), 8.08 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=5Hz), 9.06 (1H, brs), 9.57 (1H, brs).

実施例 934

- 15 2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.20 (6H, d, J=7.2Hz), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.78 (6H, s), 2.81 (3H, d, J=4.4Hz), 3.77 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s), 9.17 (1H, brs), 9.84 (1H, brs).

実施例 935

- 25 2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.20 (6H, d, J=6.8Hz), 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.78 (6H, s), 3.76

(3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.22 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34-7.36 (2H, m), 7.52 (1H, s).

実施例 936

5 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 2.76 (3H, d, J=5.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.72 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.47 (2H, s), 5.51 (1H, q, J=5.0Hz), 7.05 (1H, s), 7.24 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.4Hz), 8.55 (1H, s), 9.17 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 467.3 (MH⁺)

実施例 937

15 6-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.26-1.43 (18H, m), 2.77 (3H, d, J=4.8Hz), 3.88 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.64-4.77 (1H, m), 4.88 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.50 (2H, s), 7.99 (1H, s), 8.47-8.58 (1H, m), 9.34-9.46 (1H, m), 9.90-10.03 (1H, m).

実施例 938

25 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.33 (6H, d, J=6.0Hz), 1.35 (9H, s), 2.77 (3H, d, J=4.4Hz), 2.91 (6H, s), 3.88 (3H, s), 4

. 63-4. 80 (3H, m), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 50 (2H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 31-8. 43 (1H, m), 8. 88-8. 99 (1H, m), 9. 46-9. 60 (1H, m).

実施例 939

5 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 88-2. 13 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 86-2. 98 (2H, m), 3. 02-3. 18 (3H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 52 (1H, d, J=1. 6Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 61 (1H, d, J=1. 6Hz), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 56 (1H, s), 9. 10-9. 18 (1H, m), 9. 81-9. 88 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 546. 2 (MH⁺)

実施例 940

15 1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 6. 95 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 32 (1H, s), 7. 75 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 80 (1H, s), 9. 00 (1H, brs), 9. 30 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 429. 1 (MH⁺)

実施例 941

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロパン酸;塩酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 38 (3H, t, J=7Hz), 1. 48 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m),

4, 22-4. 40 (4H, m), 4. 82 (2H, s), 5. 40 (2H, s), 7. 08 (1H, brs), 7. 30 (1H, brs), 7. 52 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=5Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 551. 2 (MH⁺)

実施例 942

- 5 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロパン酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 30-1. 40 (12H, m), 1. 48 (6H, s), 2. 77 (3H, d, J=5Hz), 3. 30-3. 40 (2H, m), 4. 22-4. 33 (4H, m), 4. 85 (2H, s), 5. 43 (2H, s), 7. 08 (1H, brs), 7. 29 (1H, brs), 7. 98 (1H, s), 8. 54 (1H, q, J=5Hz), 9. 45 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs).

実施例 943

- 15 酢酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 33 (3H, s), 2. 65 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 7. 66 (1H, s), 8. 19-8. 21 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

- 20 MS:m/e (ESI) 509. 2 (MH⁺)

実施例 944

- 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s) 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz) 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz) 3. 82 (3H, s), 3. 93 (2H, t, J=7. 6

Hz), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.54 (2H, t, J=7.6Hz), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s) 7.54 (1H, s), 7.83 (1H, d, J=2.0Hz), 7.99 (1H, d, J=2.0Hz), 8.20 (1H, q, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s).

実施例 945

5 酢酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.37 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.31-7.34 (2H, m), 7.93 (1H, d, J=8.4Hz), 7.96 (1H, s), 9.02 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 471.1 (MH⁺)

実施例 946

酢酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.35 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.37 (3H, s), 2.83 (3H, d, J=4.4Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.86 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.33 (1H, d, J=8.4Hz), 7.54 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.4Hz), 7.97 (1H, s), 8.19-8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 466.2 (MH⁺)

実施例 947

20 {8-第 3 ブチル-6-[2-5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.91 (3H, s), 3.10-3.48 (2H, m), 3.74 (2H, d, J=4.8Hz), 4.02-4.18 (2H, m), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.37-4.48 (1H, m), 4.78 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.32 (1H

, s), 9.04 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 572.2 (MH⁺)

実施例 948

5 {8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メトキシ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキ
サジン-2-イルメトキシ}-酢酸 エチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.20 (3H, t, J=6.8Hz), 1.27 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.91
 (3H, s), 3.11-3.45 (2H, m), 3.75 (2H, d, J=4.8Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.10-4.25 (6
 10 H, m), 4.38-4.48 (1H, m), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.18 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.32 (1H
 , s), 9.04 (1H, brs), 9.36 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 600.2 (MH⁺)

実施例 949

15 2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.48-2.62 (4H, m), 2.81 (3H, d, J=4.0Hz), 3.22-3.
 42 (4H, m), 4.03 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.54 (1H, s),
 20 7.57 (1H, s), 7.63 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s).

実施例 950

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-オン;臭
化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.48-2.62 (4H, m), 3.28-3.

45 (4H, m), 4.02 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (2H, s), 7.56 (2H, s), 7.62 (2H, s).

実施例 951

5 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.12-2.24 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 3.28-3.40 (2H, m), 3.64-3.72 (2H, m), 3.74 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.85 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.54 (1H, s), 7.81 (1H, d, J=2.0Hz), 7.83 (1H, d, J=2.0Hz), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s).

実施例 952

15 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.12-2.24 (2H, m), 3.30-3.40 (2H, m), 3.68 (2H, t, J=6.8Hz), 3.74 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.80 (1H, s), 7.81 (1H, s).

20 実施例 953

3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-オキサゾリジン-2-オン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.38 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 3.82 (3H, s), 3.91 (2H, t, J=5.2Hz), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.54 (2H, t, J=5.2Hz), 4.80 (2H,

s), 5.45 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.82 (H, d, J=2.0Hz), 7.97 (1H, d, J=2.0).

実施例 954

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
5 -5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.58-1.73 (2H, m), 1.93-2.09 (2H, m), 2.69-2.81 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.13-3.45 (6HandH₂O, m), 3.93 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.09-8.31 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.14 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

実施例 955

1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
15 イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.58-1.73 (2H, m), 1.95-2.08 (2H, m), 2.68-2.81 (2H, m), 3.10-3.50 (6HandH₂O, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.57 (1H, s), 8.96-9.34 (2H, m).

20 実施例 956

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル 1)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.36 (9H, s), 1.59-1.71 (2H, m), 1.95-2.06 (2H, m), 2.70-2.82 (5H, m), 2.91 (6H, s), 3.16-3.42 (6HandH₂O, m), 3.93 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.51 (1H,

s), 7.58 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.30-8.45 (1H, m), 8.85-8.93 (1H, m), 9.48-9.57 (1H, m)

実施例 957

5 6-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28-1.47 (12H, m), 1.59-1.72 (2H, m), 1.95-2.07 (2H, m), 2.70-2.84 (5H, m), 3.13-3.
52 (6H and H₂O, m), 3.94 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.51 (
10 1H, s), 7.58 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.47-8.60 (1H, m), 9.31-9.44 (1H, m), 9.88-10.02 (1
H, m).

実施例 958

15 1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.59-1.76 (2H, m), 1.95-2.12 (2H, m), 2.68-2.85 (2H, m), 3.15-3.50 (6Ha
nd H₂O, m), 3.86 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H,
s), 7.51 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.00-9.36 (2H, m).

20 実施例 959

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.36 (9H, s), 1.87-2.13 (4H, m), 2.77 (3H, d, J=4.4Hz), 2.85-3.00 (5H, m), 3.02-3.17 (
3H, m), 3.93 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.60 (1H, s),

8.06 (1H, s), 8.30-8.45 (1H, m), 8.80-9.00 (1H, m), 9.44-9.62 (1H, m).

実施例 960

- 5 6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28-1.45 (12H, m), 1.87-2.14 (4H, m), 2.78 (3H, d, J=4.4Hz), 2.85-2.97 (2H, m), 3.02-3.17 (3H, m), 3.93 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.60 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.46-8.58 (1H, m), 9.32-9.42 (1H, m), 9.88-10.02 (1H, m).

10 実施例 961

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル1)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.39-1.50 (2H, m), 1.72-1.90 (3H, m), 2.23 (2H, d, J=6.4Hz), 2.52-2.68 (2H, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.57 (1H, s), 9.04 (1H, brs), 9.27 (1H, brs), 12.09 (1H, brs).

実施例 962

- 20 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 2.75 (6H, s), 3.82 (3H, s), 3.87 (3H, s), 4.20 (2H, q, J=7.2Hz), 4.78 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.45 (1H, d, J=2.0Hz), 7.53 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 472. 2 (MH⁺)

実施例 963

5 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 78-2. 92 (3H, m), 3. 59 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8 Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 92-8. 08 (2H, m), 8. 21 (1H, s), 8. 40 (1H, s), 8. 56 (1H, s), 9. 19 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

10 実施例 964

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 45 (9H, s), 3. 59 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 38 (1 H, s), 7. 96-8. 05 (3H, m), 8. 38 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 498. 1 (MH⁺)

実施例 965

20 1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 01 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 74 (3H, s), 3. 13 (2H, q, J=7. 2Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 47 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 53 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 02 (1H, brs), 9. 27 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 500. 2 (MH⁺)

実施例 966

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキ
ソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン
5 酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 74 (3H, s), 2. 82 (3H, d, J=
4. 8Hz), 3. 13 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (
2H, s), 7. 48 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54-7. 55 (2H, m), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s), 9
10 . 14 (1H, brs), 9. 81 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 495. 2 (MH⁺)

実施例 967

3-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イ
15 ル}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7Hz), 2. 80 (2H, t, J=8Hz), 3. 47 (2H, m)
, 3. 70, 2H, t, J=8Hz), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 20-4. 27 (4H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 45 (2H, s)
, 7. 25 (2H, m), 7. 33 (1H, brs), 9. 05 (1H, brs), 9. 32 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 523. 0 (MH⁺)

実施例 968

1-(3-第 3 ブチル-4-メ トキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエト
キシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭
化水素酸塩

25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 3. 59 (3H, s), 4. 10 (2H, q, J=

6. 8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 82 (2H, s), 5. 56 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 94-8. 05 (3H, m), 8. 38 (1H, m), 9. 07 (1H, m), 9. 30 (1H, m).

実施例 969

5 1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フル
オロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノ
ン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 74 (3H, s), 3. 13 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 80 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 47 (1H, d, J=2. 0Hz)
10 , 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 07 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 472. 2 (MH⁺)

実施例 970

15 1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シク
ロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 32 (1H, m), 2. 74 (3H, s), 3. 13
(2H, q, J=7. 0Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7.
72 (1H, d, J=7. 8Hz), 8. 09 (1H, d, J=7. 8Hz), 9. 43 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

20 MS:m/e (ESI) 435. 1 (MH⁺)

実施例 971

25 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキ
シ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化
水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 3. 59 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=

6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.82 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.94-8.04 (3H, m), 8.38 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 526.2 (MH⁺)

実施例 972

- 5 6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキ
ソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-
カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.01 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.37 (12H, m), 2.74 (3H, s), 2.78 (3H, d, J=4.8Hz), 3.13 (2
10 H, q, J=7.0Hz), 3.83 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=7.0Hz), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.47 (1H
, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, d, J=2.0Hz), 7.99 (1H, s), 8.53 (1H, q, J=4.8Hz), 9.40 (1H, brs
, 9.92 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 496.2 (MH⁺)

実施例 973

- 15 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-
メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニ
ル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.35-1.54 (15H, m), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.69 (3H, s), 4.15-4.40 (4H, m), 4.86 (2H, s
20), 5.52 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.61 (1H, s), 7.64 (1H, s), 8.13-8.28 (1H, m), 8.56 (1H, s
, 9.21 (1H, brs), 9.87 (1H, brs).

実施例 974

- 25 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エス
テル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.35-1.50 (15H, m), 3.68 (3H, s), 4.11 (3H, t, J=6.8Hz), 4.15-4.40 (4H, m), 4.81 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.62 (1H, s), 8.92-9.43 (2H, m).

実施例 975

- 5 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.42 (3H, t, J=6.8Hz), 1.44 (9H, s), 3.69 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.82 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.63 (1H, s), 9.00-9.40 (2H, m).

実施例 976

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル 1}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

- 15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.01 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 2.74 (3H, s), 2.77 (3H, d, J=5.0Hz), 2.91 (6H, s), 3.12 (2H, q, J=7.0Hz), 3.83 (3H, s), 4.73- (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.47 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=5.0Hz), 8.92 (1H, brs), 9.51 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 494.2 (MH⁺)

- 20 実施例 977

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 0.98 (6H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.83 (3H, d, J=4.8Hz), 3.16 (4H, q, J=7.2Hz), 3.86 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.50 (

1H, d, J=2.0Hz), 7.54(1H, s), 7.55(1H, d, J=2.0Hz), 8.21(1H, q, J=4.8Hz), 8.56(1H, s), 9.07(1H, brs), 9.80(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 509.2 (MH⁺)

実施例 978

- 5 1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 0.98(6H, t, J=7.0Hz), 1.29(3H, t, J=7.0Hz), 1.37(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 3.16
10 (4H, q, J=7.0Hz), 3.86(3H, s), 4.12(2H, q, J=7.0Hz), 4.21(2H, q, J=7.0Hz), 4.79(2H, s), 5.47(2H, s), 7.34(1H, s), 7.48(1H, d, J=1.6Hz), 7.54(1H, d, J=1.6Hz), 9.02(1H, brs), 9.28(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 514.2 (MH⁺)

実施例 979

- 15 1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 0.98(6H, t, J=7.0Hz), 1.37(9H, s), 3.16(4H, q, J=7.0Hz), 3.86(3H, s), 3.87(3H, s), 3.
20 .96(3H, s), 4.81(2H, s), 5.49(2H, s), 7.37(1H, s), 7.49(1H, d, J=2.0Hz), 7.54(1H, d, J=2.0Hz), 9.06(1H, brs), 9.30(1H, brs).

MS:m/e (ESI) 486.2 (MH⁺)

実施例 980

- 25 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル 1]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 39-1. 56 (2H, m), 1. 73-1. 92 (3H, m), 2. 30 (2H, d, J=6.4Hz), 2. 52-2. 68 (2H, m), 3. 92 (3H, s), 4. 00-4. 15 (4H, m), 4. 20 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 90-9. 35 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 612. 3 (MH⁺)

実施例 981

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェニル

10 エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 44 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 3. 73 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 75 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 550. 1 (MH⁺)

実施例 982

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル

エステル;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 44 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 3. 73 (3H, s), 3. 87 (3H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 81 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 75 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 522. 1 (MH⁺)

実施例 983

25 6-[2-(3-第3ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン

酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

0.98(6H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.37(12H, m), 2.78(3H, d, J=4.4Hz), 3.16(4H, q, J=7.0Hz), 3.86(3H, s), 4.24(2H, q, J=7.0Hz), 4.88(2H, s), 5.52(2H, s), 7.49(1H, s), 7.55(1H, s), 8.00(1H, s), 8.53(1H, q, J=4.4Hz), 9.39(1H, brs), 9.94(1H, brs).

MS:m/e(ESI)510.2(MH⁺)

実施例 984

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.31-1.43(15H, m), 2.75(6H, s), 2.83(3H, d, J=4.6Hz), 4.13(2H, q, J=7.0Hz), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.45(1H, s), 7.54(1H, s), 7.56(1H, s), 8.21(1H, q, J=4.6Hz), 8.55(1H, s), 9.13(1H, brs), 9.81(1H, brs).

MS:m/e(ESI)495.2(MH⁺)

実施例 985

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

1.36(9H, s), 1.41(3H, t, J=6.8Hz), 1.54-1.67(2H, m), 1.84-1.96(2H, m), 2.66-2.76(2H, m), 2.82(3H, d, J=4.8Hz), 3.18-3.36(2H, m), 3.52-3.68(1H, m), 3.94(3H, s), 4.27(2H, q, J=6.8Hz), 4.73(1H, d, J=4.0Hz), 4.84(2H, s), 5.49(2H, s), 7.52(1H, s), 7.54(1H, s), 7.58(1H, s), 8.12-8.25(1H, m), 8.55(1H, s), 9.14(1H, brs), 9.83(1H, brs).

25 実施例 986

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]

ル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 1.54-1.68 (2H, m), 1.84-1.96 (2H, m), 2.65-2.78 (2H, m), 3.17-3.42 (2H, m), 3.58-3.67 (1H, m), 3.94 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.73 (1H, d, J=3.2Hz), 4.78 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.56 (1H, s), 8.95-9.11 (1H, m), 9.18-9.36 (1H, brs).

実施例 987

10 6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.26-1.50 (12H, m), 1.50-1.68 (2H, m), 1.84-2.03 (2H, m), 2.64-2.86 (5H, m), 3.12-3.68 (3H, m), 3.94 (3H, s), 4.23 (2H, q, J=6.8Hz), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.44-7.70 (2H, m), 7.99 (1H, s), 8.41-8.63 (1H, m), 9.37 (1H, brs), 9.94 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 538.3 (MH⁺)

実施例 988

20 1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.36 (9H, s), 1.54-1.70 (2H, m), 1.84-2.00 (2H, m), 2.65-2.80 (2H, m), 3.19-3.50 (2H, m), 3.55-3.70 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.73 (1H, d, J=4.0Hz), 4.80 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.56 (1H, s), 8.99-9.40 (2H, m).

実施例 989

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

ル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1.00-1.19 (4H, m), 1.36 (9H, s), 1.54-1.68 (2H, m), 1.84-1.96 (2H, m), 2.24-2.37 (1H, m), 2.64-2.78 (2H, m), 3.18-3.46 (2H, m), 3.53-3.70 (1H, m), 3.94 (3H, s), 4.73 (1H, d, J=4.0Hz), 4.82 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.73 (1H, d, J=8.0Hz), 8.10 (1H, d, J=8.0Hz), 9.50-9.76 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 477.2 (MH⁺)

実施例 990

10 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェニルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.08-1.10 (4H, m), 1.45 (9H, s), 2.30-2.33 (1H, m), 2.67 (6H, s), 3.73 (3H, s), 4.83 (2H, s), 5.80 (2H, s), 7.68 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=7.8Hz), 7.53 (1H, s), 8.10 (1H, d, J=7.8Hz).

MS:m/e (ESI) 485.1 (MH⁺)

実施例 991

20 1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.41 (15H, m), 2.75 (6H, s), 4.08-4.16 (4H, m), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.44 (1H, s), 7.54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 500.2 (MH⁺)

実施例 992

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.36 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38 (9H, s), 2.75 (6H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.44 (1H, d, J=1.6Hz), 7.54 (1H, d, J=1.6Hz).

MS:m/e (ESI) 472.2 (MH⁺)

実施例 993

- 10 1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38-1.41 (12H, m), 2.61 (6H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.68 (1H, s), 9.01 (1H, brs), 9.26 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 472.2 (MH⁺)

実施例 994

- 20 2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.37 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38 (9H, s), 2.75 (6H, s), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 2.91 (6H, s), 4.13 (2H, q, J=7.0Hz), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.55 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=4.6Hz).

MS:m/e (ESI) 494.2 (MH⁺)

実施例 995

6-[2-(3-第 3 ブチル-5 ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.34-1.39 (15H, m), 2.75 (6H, s), 2.78 (3H, d, $J=4.6\text{Hz}$), 4.13 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4.24 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4.87 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.45 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.53 (1H, q, $J=4.6\text{Hz}$), 8.55 (1H, s), 9.39 (1H, brs), 9.92 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 496.2 (MH $^+$)

10 実施例 996

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1.44 (9H, s), 2.67 (6H, s), 2.78 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 2.92 (6H, s), 3.72 (3H, s), 4.75 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.16 (1H, s), 7.68 (1H, s), 7.75 (1H, s), 8.07 (1H, s), 8.37 (1H, q, $J=4.8\text{Hz}$).

MS: m/e (ESI) 544.2 (MH $^+$)

実施例 997

20 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1.08-1.10 (4H, m), 1.37 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1.39 (9H, s), 2.75 (6H, s), 4.13 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4.81 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.45 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.55 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.72 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.09 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$).

MS:m/e (ESI) 435. 2 (MH⁺)

実施例 998

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミ
ノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセ
5 チル]-フェニル エステル; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 45 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 24 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 90 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 75 (1H, s), 8. 01 (1H, s), 8. 53 (1H, q, J=4. 8Hz), 9. 43 (1H, brs), 9. 98 (1H, brs).

10 MS:m/e (ESI) 546. 1 (MH⁺)

実施例 999

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒ
ドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステ
15 ル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 08-1. 10 (4H, m), 1. 40-1. 44 (12H, m), 2. 31-2. 34 (1H, m), 3. 69 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 59 (2H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 7. 73 (1H, d, J=8. 2Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 2Hz), 9. 50 (1H, brs), 9. 68 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 486. 1 (MH⁺)

20 実施例 1000

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチル
カルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フ
25 ェニル エステル; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 40-1. 44 (12H, m), 2. 78 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 69 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 74 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 16 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8

. 38 (1H, q, J=4. 4Hz).

MS:m/e (ESI) 545. 2 (MH⁺)

実施例 1001

5 1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピ
ル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素
酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 98 (6H, t, J=7. 0Hz), 1. 06-1. 10 (4H, m), 1. 37 (9H, s), 2. 29-2. 34 (1H, m), 3. 15-3. 19 (4H, m), 3. 86 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 55 (1H, s),
 10 7. 72 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 0Hz), 9. 30 (1H, brs), 9. 62 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 449. 2 (MH⁺)

実施例 1002

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチ
ル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 98 (6H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 78 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 16 (4H, q, J=7. 0Hz), 3. 85 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 49 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 55 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 92 (1H, brs), 9
 20 . 53 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 508. 2 (MH⁺)

実施例 1003

25 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-
メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-
フェニル エステル;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 40-1. 44 (12H, m), 2. 78 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 69 (3H, s), 4. 21-4. 29 (4H, m), 4. 90 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 60 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 00 (1H, s), 8. 53 (1H, q, J=4. 4Hz), 9. 43 (1H, brs), 9. 98 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 547. 1 (MH⁺)

5 実施例 1004

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 2. 76 (3H, d, J=5.2Hz), 3. 72 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 5. 50 (1H, q, J=5.2Hz), 7. 04 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 33 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 472. 1 (MH⁺)

実施例 1005

15 1-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシフェニル]-2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル);臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 54-1. 68 (2H, m), 1. 83-1. 96 (2H, m), 2. 64-2. 78 (2H, m), 3. 21-3. 48 (2H, m), 3. 58-3. 69 (1H, m), 3. 87 (3H, s), 3. 94 (3H, s), 4. 22 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 73 (1H, d, J=4.0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 9. 00-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 34 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 1006

25 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシフェニル エス

テル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 43 (9H, s), 3. 65 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 21 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 7. 63 (1H, s), 8. 99-9. 41 (2H, m).

実施例 1007

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル エステル

ル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 03-1. 20 (4H, m), 1. 43 (9H, s), 2. 27-2. 37 (1H, m), 3. 66 (3H, s), 3. 97 (3H, s), 4. 84 (2H, s), 5. 65 (2H, s), 7. 64 (2H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8. 4Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 4Hz), 9. 52-9. 82 (2H, m).

実施例 1008

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル

エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 43 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 84 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 55 (3H, s), 4. 00 (3H, s), 4. 30 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 56 (1H, s), 7. 87 (1H, s), 7. 91 (1H, s), 8. 17-8. 28 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 88 (1H, brs).

実施例 1009

メタンスルホン酸 3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル エス

テル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 54 (3H, s), 4. 00 (3H, s), 4. 13 (3H, t, J=6. 8Hz), 4. 23 (2H, t, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 36 (1H, s), 7. 86 (1H, s), 7. 90 (1H, s), 9. 01-9. 16 (1H, m), 9. 28-9. 43 (1H, m).

実施例 1010

5 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 41 (9H, s), 1. 54-1. 70 (2H, m), 1. 84-1. 98 (2H, m), 2. 64-2. 84 (5H, m) 2. 91 (6H, s), 3. 19-3. 46 (2H, m), 3. 54-3. 72 (1H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 52-4. 58 (3H, m), 5. 45 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 57 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 31-8. 50 (1H, m), 8. 80-9. 05 (1H, m), 9. 40-9. 65 (1H, m).

実施例 1011

15 2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 41 (3H, t, J=7Hz), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 77 (6H, s), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 83 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 51 (1H, brs), 7. 54 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 8. 21 (1H, m), 8. 56 (1H, brs), 9. 21 (1H, brs), 9. 87 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 484. 4 (MH⁺)

実施例 1012

25 6-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7Hz), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 78 (9H, m), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 84 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=7Hz), 4. 88 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 50 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 8. 00 (1H, s), 8. 54 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 485. 3 (MH⁺)

5 実施例 1013

2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 40 (3H, t, J=7Hz), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 77 (6H, s), 3. 83 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 21 (2H, q, J=7Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1H, brs), 7. 50 (1H, brs), 7. 65 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 490. 4 (MH⁺)

実施例 1014

15 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 02-1. 13 (4H, m), 1. 68 (3H, s), 1. 74 (3H, s), 2. 31 (1H, m), 2. 77 (6H, s), 3. 83 (3H, s), 4. 83 (2H, s), 5. 57 (2H, s), 7. 51 (1H, brs), 7. 66 (1H, brs), 7. 72 (1H, d, J=8Hz), 8. 10 (1H, d, J=8Hz), 9. 48 (1H, brs), 9. 67 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 425. 3 (MH⁺)

実施例 1015

25 6-ジメチルアミノ-2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 67 (3H, s), 1. 73 (3H, s), 2. 77 (9H, m), 2. 92 (6H, s), 3. 83 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2Hz), 7. 66 (1H, d, J=2Hz), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=5Hz), 8. 94 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 484. 4 (MH⁺)

実施例 1016

メタン磺酸 2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 2. 67 (6H, s), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 73 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 55 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 76 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

実施例 1017

15 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[1,3]オキサジナン-3-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 32 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 56-1. 68 (2H, m), 3. 42-3. 48 (2H, m), 3. 89 (3H, s), 3. 80-3. 92 (2H, m), 4. 13 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 4. 82 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 36 (2H, s), 7. 60 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 77 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 1018

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン

ドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (9H, s), 1. 80-1. 92 (1H, m), 1. 98-2. 11 (1H, m), 2. 74-2. 84 (4H, m) 2. 94 (6H, s), 3. 0
8-3. 18 (1H, m), 3. 26-3. 50 (2H, m), 3. 65 (3H, s), 4. 32-4. 47 (1H, m), 4. 75 (2H, s), 4. 64-
5. 01 (1H, m), 5. 47 (2H, s), 7. 17 (1H, s), 7. 35 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 8. 09 (1H, s), 8. 30-8
. 54 (1H, m), 8. 94 (1H, brs), 9. 55 (1H, brs).

実施例 1019

1-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 79-1. 92 (1H, m), 1. 98-2. 12 (1H, m), 2. 90-2. 99 (1H, m), 3. 08-3. 18 (1H,
m), 3. 20-3. 60 (2H, m), 3. 65 (3H, s), 3. 89 (3H, s), 3. 97 (3H, s), 4. 30-4. 43 (1H, m), 4. 81
(2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 43 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 31 (1H,
brs).

実施例 1020

2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェ
ニル]-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 21 (6H, d, J=7. 2Hz), 1. 31 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 42 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 54-1. 68 (2H, m)
, 1. 86-1. 96 (2H, m), 2. 70-2. 82 (2H, m), 3. 20-3. 68 (3H, m), 3. 88 (3H, s), 4. 13 (2H, q, J=
7. 2Hz), 4. 23 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 74 (1H, d, J=4. 0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 35 (
1H, s), 7. 43 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 98-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 38 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 528. 4 (MH⁺)

実施例 1021

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1.20 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.12-3.17 (2H, m), 3.73 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.29 (1H, t, J=6.0Hz), 5.46 (2H, s), 7.11 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.18 (1H, brs), 9.80 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 481.3 (MH⁺)

10 実施例 1022

1-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1.20 (3H, t, J=7.0Hz), 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.12-3.19 (2H, m), 3.72 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.29 (1H, t, J=6.0Hz), 5.45 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.22 (1H, s), 7.33 (1H, s), 9.03 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 486.3 (MH⁺)

20 実施例 1023

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 25 1.20 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 2.92 (6H, s), 3.12-3.19 (2H, m), 3.72 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.28 (1H, t, J=5.8Hz), 5.42 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.15 (

1H, s), 7.23 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=4.6Hz), 8.92 (1H, brs), 9.52 (1H, brs)

MS:m/e (ESI) 480.3 (MH⁺)

実施例 1024

- 5 1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.39 (9H, s), 2.61 (6H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.36 (1H, s), 7.63 (1H, d, J=2.0Hz), 7.68 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 444.2 (MH⁺)

実施例 1025

- 15 6-[2-(3-第3ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.20 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.37 (12H, m), 2.78 (3H, d, J=5.0Hz), 3.12-3.18 (2H, m), 3.73 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=7.0Hz), 4.87 (2H, s), 5.29 (1H, t, J=6.0Hz), 5.49 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.99 (1H, s), 8.52 (1H, q, J=5.0Hz).

MS:m/e (ESI) 482.3 (MH⁺)

実施例 1026

- 25 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 2.75-2.78 (6H, m), 2.91 (6H, s), 3.72 (3H, s), 4.71 (2H, s), 5.40 (2H, s), 5

. 49 (1H, q, J=4. 8Hz), 7. 05 (1H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 8. 05 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4. 8Hz).

MS:m/e (ESI) 466. 3 (MH⁺)

実施例 1027

- 5 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40 (9H, s), 1. 44 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 79-1. 92 (1H, m), 1. 98-2. 12 (1H, m), 2. 85 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 92-2. 99 (1H, m), 3. 08-3. 18 (1H, m), 3. 20-3. 65 (2H, m), 3. 66 (3H, s), 4. 30 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 35-4. 45 (1H, m), 4. 86 (2H, s), 5. 43-5. 58 (2H, m), 7. 36 (1H, s), 7. 44 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 16-8. 30 (1H, m), 8. 58 (1H, s), 9. 17 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

実施例 1028

- 15 6-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34-1. 38 (12H, m), 2. 75-2. 78 (6H, m), 3. 72 (3H, s), 4. 24 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 05 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 52 (1H, q, J=5. 2Hz).

- 20 MS:m/e (ESI) 468. 3 (MH⁺)

実施例 1029

- 25 (1-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 19 (6H, d, J=7. 2Hz), 1. 32-1. 48 (5H, m), 1. 70-1. 87 (3H, m), 2. 16-2. 26 (2H, m), 2. 54-

2.68 (2H, m), 2.82 (3H, d, J=3.6Hz), 3.85 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.41 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.55 (1H, s), 8.13-8.24 (1H, m), 8.55 (1H, s), 9.16 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 565.3 (MH⁺)

5 実施例 1030

1-(5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル)-ピペリジン-4-イル)-酢酸;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1.19 (6H, d, J=6.8Hz), 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.33-1.48 (5H, m), 1.72-1.86 (3H, m), 2.18-2.25 (2H, m), 2.54-2.66 (2H, m), 3.85 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.54 (1H, s), 8.99-9.08 (1H, m), 9.24-9.36 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 570.4 (MH⁺)

15 実施例 1031

1-(3-第3ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1.20 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 3.12-3.19 (2H, m), 3.73 (3H, s), 3.87 (3H, s), 4.79 (2H, s), 5.29 (1H, t, J=6.0Hz), 5.45 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.36 (1H, s), 9.00 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 458.2 (MH⁺)

実施例 1032

25 1-(3-第3ブチル-5-エチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸

塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08-1.10 (4H, m), 1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.37 (9H, s), 2.26-2.35 (1H, m), 3.12-3.18 (2H, m), 3.73 (3H, s), 4.81 (2H, s), 5.29 (1H, t, J=6.0 Hz), 5.54 (2H, s), 7.11 (1H, s), 7.23 (1H, s), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.09 (1H, d, J=8.0 Hz).

MS: m/e (ESI) 421.2 (MH⁺)

実施例 1033

1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸

10 塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.36-1.41 (15H, m), 4.08-4.15 (4H, m), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.78 (2H, s), 5.44 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.50 (1H, s), 9.00 (1H, brs), 9.30 (1H, brs), 9.44 (1H, brs).

15 MS: m/e (ESI) 473.2 (MH⁺)

実施例 1034

2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36-1.43 (15H, m), 2.82 (3H, d, J=4.6 Hz), 4.12 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.83 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.43 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.6 Hz), 8.55 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 468.2 (MH⁺)

25 実施例 1035

エチル-カルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミ

ノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.08 (3H, t, J=7.0Hz), 1.27-1.33 (15H, m), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 3.06-3.14 (2H, m), 4.03-4.14 (4H, m), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.80 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.86 (1H, t, J=4.8Hz), 9.02 (1H, brs), 9.33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 544.3 (MH⁺)

実施例 1036

エチル-カルバミン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.09 (3H, t, J=7.0Hz), 1.31 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.05-3.11 (2H, m), 4.07 (2H, q, J=7.0Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.85 (2H, s), 5.51 (2H, s), 7.52 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.86 (1H, t, J=6.0Hz), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 539.4 (MH⁺)

実施例 1037

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 1.44 (9H, s), 2.10-2.17 (2H, m), 2.69 (2H, t, J=7.2Hz), 3.67 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.82 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.66 (1H, s), 9.08 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 590.2 (MH⁺)

実施例 1038

1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

2.09 (3H, s), 2.80 (6H, s), 3.72 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.81 (2H, s), 5.04 (1H, m), 5.23 (1H, m), 5.49 (2H, s), 7.37 (1H, brs), 7.40-7.42 (2H, m).

MS: m/e (ESI) 442.3 (MH⁺)

実施例 1039

10 メタン sulfon 酸 2-第 3 ブチル-6-(3-シアノプロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル; 臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

15 1.42 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1.44 (9H, s), 2.11-2.17 (2H, m), 2.69 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.83 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 3.67 (3H, s), 4.25-4.30 (4H, m), 4.86 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.64 (1H, s), 7.67 (1H, s), 8.21 (1H, q, $J=4.8\text{Hz}$), 8.56 (1H, s), 9.20 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 585.3 (MH⁺)

実施例 1040

20 1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

25 1.18 (3H, s), 1.28 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.35 (9H, s), 1.39 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.59-1.80 (4H, m), 2.88-3.09 (4H, m), 3.93 (3H, s), 4.11 (3H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4.21 (3H, q, $J=6.8\text{Hz}$), 4.78 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.55 (1H, s), 8.98-9.10 (1H, m), 9.20

-9.33 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 556.4 (MH⁺)

実施例 1041

5 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピペラジン-1-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.21 (4H, brs), 3.32 (4H, brs), 3.94 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.55 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.04-9.16 (3H, m), 9.40 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 527.3 (MH⁺)

実施例 1042

15 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.16 (3H, t, J=6.8), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.68-2.95 (6H, m), 3.18 (3H, s), 3.20-3.48 (4H, m), 3.81 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=6.8Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.46-7.60 (3H, m), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s), 9.16 (1H, brs), 9.83 (1H, s).

20 MS:m/e (ESI) 525.4 (MH⁺)

実施例 1043

25 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 2.80 (3H, s), 2.91 (6H, s), 3.18 (3H, s), 3.20-3.48

(4H, m), 3.81 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.43 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.36 (1H, q, J=4.0Hz).

MS:m/e (ESI) 524.3 (MH⁺)

実施例 1044

- 5 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシエチル)-メチルアミノ]-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 2.81 (3H, s), 3.18 (3H, s), 3.22-3.44 (4H, m), 3.81 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, d, J=2.0Hz), 7.52 (1H, d, J=2.0Hz).
- 10

実施例 1045

- 15 1-(3-第 3 ブチル-4-エトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.34-1.42 (15H, m), 3.00 (4H, brs), 3.79 (4H, brs), 4.01 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.29 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.47 (1H, d, J=2.0Hz), 7.61 (1H, d, J=2.0Hz), 9.02 (13H, brs), 9.27 (1H, brs)
- 20

MS:m/e (ESI) 542.3 (MH⁺)

実施例 1046

- 25 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-エトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34-1. 43 (15H, m), 2. 83 (3H, d, J=4. 6Hz), 3. 00 (4H, brs), 3. 79 (4H, brs), 4. 25-4. 32 (4H, m), 4. 83 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 49 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 62 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 6Hz), 8. 55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 537. 4 (MH⁺)

5 実施例 1047

1-[3-第 3 ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

10 1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 45 (9H, s), 1. 50 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 44 (2H, t, J=5. 4Hz), 3. 83 (2H, t, J=5. 4Hz), 3. 89 (3H, s), 4. 18 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 24 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 91 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 55 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 66 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS:m/e (ESI) 502. 3 (MH⁺)

実施例 1048

15 1-[3-第 3 ブチル-5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 44 (9H, s), 3. 38 (2H, t, J=5. 6Hz), 3. 83 (2H, t, J=5. 6Hz), 3. 86 (3H, s), 3. 94 (3H, s), 4. 02 (3H, s), 4. 91 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 7. 25 (1H, s), 7. 40 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, d, J=2. 0Hz).

実施例 1049

25 1-{3-第 3 ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェニル}-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 49 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 04 (3H, brs), 3. 38-3. 75 (4H, m), 3. 95 (3H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 21 (1H, s), 7. 77-7. 95 (2H, m).

MS:m/e (ESI) 516. 4 (MH⁺)

実施例 1050

- 5 酢酸 2-({3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-メチルアミノ)-エチル エステル; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1. 27 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 87 (3H, s), 2. 81 (3H, s), 2. 72-2. 85 (2H, m), 3. 38 (2H, t, J=6. 0Hz), 3. 81 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 9. 07 (1H, brs), 9. 44 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH⁺)

実施例 1051

- 15 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3, 4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 88-2. 95 (2H, m), 3. 50-3. 59 (2H, m), 3. 61 (3H, s), 4. 02 (2H, brs), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 37-5. 60 (2H, m), 7. 29 (1H, s), 7. 38 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 12-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 14 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

実施例 1052

- 25 1-[3-第 3 ブチル-5-(3, 4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 87-2. 97 (2H, m), 3. 48-3. 58 (2H, m), 3. 61 (3H, s), 4. 02 (2H, brs), 4. 11 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 21 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 36-5. 58 (2H, m), 7. 28 (1H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 37 (1H, s), 9. 04 (1H, brs), 9. 26 (1H, brs).

実施例 1053

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-((3R, 4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.4Hz), 2. 82-3. 11 (2H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 72-3. 79 (1H, m), 4. 10-4. 25 (1H, m), 4. 27 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 38-5. 62 (2H, m), 7. 32 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 14-8. 28 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 13 (1H, brs), 9. 83 (1H, brs).

実施例 1054

1-[3-第 3 ブチル-5-((3R, 4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 91-2. 99 (1H, m), 3. 03-3. 12 (1H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 71-3. 79 (1H, m), 4. 10 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 10-4. 30 (3H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 38-5. 60 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 99-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 40 (1H, m).

実施例 1055

- 6-(2-{3-第 3 ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキソ-エチル)-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]

ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩1H-NMR (DMSO-d6) δ :

1. 26-1.44 (3H, m), 1.36 (9H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 2.81 (3H, s), 3.17 (2H, t, J=6.4 Hz), 3.52 (2H, t, J=6.4Hz), 3.82 (3H, s), 4.23 (2H, q, J=6.8Hz), 4.87 (2H, s), 5.60 (2H, s), 7.51-7.53 (2H, m), 8.00 (1H, s), 8.57 (1H, q, J=4.0Hz), 9.57 (1H, brs), 9.97 (1H, brs).

実施例 1056

- 2-(2-{3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-4-メトキシフェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 2.75-2.90 (3H, m), 3.06-3.26 (2H, m), 3.14 (3H, s), 3.54 (2H, t, J=4.0Hz), 3.82 (3H, s), 4.26 (2H, q, J=6.8Hz), 4.83 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.45-7.60 (3H, m), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.55 (1H, s), 9.33 (1H, brs), 9.91 (1H, brs).

15 実施例 1057

{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシフェニル}-メチルアミノ)-アセトニトリル;臭化水素酸塩

1H-NMR (DMSO-d6) δ :

- 20 1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.35-1.42 (12H, m), 2.87 (3H, s), 3.80 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q, J=7Hz), 4.36 (2H, s), 4.81 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.35 (1H, brs), 7.58 (1H, brs), 7.66 (1H, brs), 9.06 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

実施例 1058

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-アミノ)-4-メトキシフェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 35-1. 42 (12H, m), 2. 81 (3H, d, J=5Hz), 3. 71 (3H, s), 4. 24-4. 38 (4H, m), 4. 84 (2H, s),
5. 46 (2H, s), 6. 05 (1H, m), 7. 30 (1H, brs), 7. 39 (1H, brs), 7. 50 (1H, brs), 8. 23 (1H, m),
8. 52 (1H, s).

5 MS:m/e (ESI) 492. 2 (MH⁺)

実施例 1059

{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニルアミノ}-アセトニトリル;

臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7Hz), 1. 35-1. 42 (12H, m), 3. 72 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7Hz), 4. 21 (2H, q,
J=7Hz), 4. 36 (2H, m), 4. 81 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 6. 15 (1H, m), 7. 32 (1H, brs), 7. 34 (1H,
brs), 7. 39 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 497. 2 (MH⁺)

15 実施例 1060

2-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-メチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-
オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 35-1. 42 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 2. 87 (3H, s), 3. 81 (3H, s), 4. 25-4. 37 (4H, m),
4. 85 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 54 (1H, brs), 7. 58 (1H, brs), 7. 67 (1H, brs), 8. 20 (1H, m),
8. 55 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 506. 2 (MH⁺)

実施例 1061

25 1-(3-第3ブチル-4-メトキシメトキシ-5-モロフォリン-4-イル-フェニ
ル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37-1.43 (15H, m), 2.94 (4H, brs), 3.54 (3H, s), 3.79 (4H, brs),
 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.77 (2H, s), 5.34 (2H, s), 5.45 (2H, s),
 5 7.32 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.02 (1H, brs), 9.27 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 558.3 (MH⁺)

実施例 1062

- 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-((3R,4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イ
 ル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-
 10 ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.36 (9H, s), 2.77 (3H, d, J=4.0Hz), 2.85-3.14 (8H, m), 3.29 (3H, s), 3.62 (3H, s), 3.70
 -3.80 (1H, m), 4.13-4.27 (1H, m), 4.72 (2H, s), 5.35-5.60 (2H, m), 7.15 (1H, s), 7.31 (1
 H, s), 7.41 (1H, s), 8.05 (1H, s), 8.30-8.44 (1H, m), 8.90 (1H, brs), 9.52 (1H, brs).

- 15 実施例 1063

6-{2-[3-第 3 ブチル-5-((3R,4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イ
 ル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒド
 ロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1.26-1.54 (12H, m), 2.77 (3H, d, J=4.8Hz), 2.70-3.01 (1H, m), 3.02-3.13 (1H, m), 3.30
 (3H, s), 3.40-3.58 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.71-3.82 (1H, m), 4.10-4.45 (3H, m), 4.87 (2
 H, s), 5.23 (1H, d, J=3.6Hz), 5.40-5.70 (2H, m), 7.31 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.99 (1H, s)
 , 8.40-8.63 (1H, m), 9.28-9.48 (2H, m).

実施例 1064

- 25 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシメトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-
 エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸

メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 40-1. 43 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 95 (4H, brs), 3. 55 (3H, s), 3. 79 (4H, brs), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 34 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 52-7. 54 (2H, m), 7. 65 (1H, s), 8. 21 (1H, d, J=4. 8Hz), 9. 16 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 553. 3 (MH⁺)

実施例 1065

1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-モルフォリノフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 38-1. 41 (12H, m), 2. 78-2. 79 (4H, m), 3. 81-3. 83 (4H, m), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 67 (1H, s), 7. 73 (1H, s), 9. 03 (1H, brs), 9. 20 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH⁺)

- 15 実施例 1066

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-モルフォリノフェニル)-2-オキソエチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 . 1. 40-1. 43 (12H, m), 2. 77-2. 80 (4H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 81-3. 83 (4H, m), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 68 (1H, s), 7. 74 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 14 (1H, brs), 9. 20 (1H, brs), 9. 82 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 509. 3 (MH⁺)

実施例 1067

- 25 2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-1-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリノフェニル)-エタノン;臭化

水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 20 (6H, d, J=6.8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 40 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 90-3. 10 (5H, m),
5 3. 66-3. 88 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 04-4. 26 (4H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1
H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 34 (1H, brs).

実施例 1068

2-(2-{3-第 3 ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

- 10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 96 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.0Hz), 3. 12-3. 28 (4H, m), 3. 20-3. 65 (2H, m), 3. 84 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 48-7. 60 (3H, m), 8. 21 (1H, brs), 8. 56 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

- 15 MS:m/e (ESI) 525. 3 (MH⁺)

実施例 1069

2-(2-{3-第 3 ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0. 95 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 36 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4.0Hz), 2. 91 (6H, s), 3. 08-3. 18 (4H, m), 3. 47 (2H, t, J=5.6Hz), 3. 84 (3H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 08 (1H, s), 3. 37 (1H, q, J=4.0Hz), 9. 08 (1H, brs), 9. 60 (1H, brs).

- 25 実施例 1070

1-{3-第 3 ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル}

ル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.96 (3H, t, J=6.4Hz), 1.28 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 3.14
5 -3.26 (4H, m), 3.47 (2H, t, J=6.0Hz), 3.84 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.20 (2H, q, J
=6.8Hz), 4.79 (2H, s), 5.61 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.60 (1H, s), 9.10 (1H, b
rs), 9.57 (1H, brs).

実施例 1071

10 6-(2-{3-第 3 ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フ
エニル}-2-オキソ-エチル)-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.96 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 2.78 (3H, d, J=4.0Hz), 3.14
-3.28 (4H, m), 3.30-3.64 (2H, m), 3.84 (3H, s), 4.24 (2H, q, J=6.8Hz), 4.88 (2H, s), 5.5
15 6 (2H, s), 7.53 (1H, s), 7.55 (1H, s), 8.00 (1H, s), 8.55 (1H, q, J=4.0Hz), 9.49 (1H, brs)
, 9.96 (1H, brs).

実施例 1072

20 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキ
シ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイ
ンドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.18 (3H, s), 1.36 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=6.8Hz), 1.57-1.76 (4H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8
Hz), 2.90-3.07 (4H, m), 3.93 (3H, s), 4.16-4.37 (3H, m), 4.83 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.5
3 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.56 (1H, s), 8.10-8.26 (1H, m), 8.55 (1H, s).

25 実施例 1073

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキ

シ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-
イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, s), 1. 35 (9H, s), 1. 57-1. 76 (4H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 2. 91 (6H, s), 2. 94
5 -3. 07 (4H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 30 (1H, s), 4. 73 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 56 (1H, s), 8. 06 (1H, s), 8. 28-8. 42 (1H, m), 8. 80-8. 98 (1H, m), 9. 38-9. 60 (1H, m).

実施例 1074

10 6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-
シ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 18 (3H, s), 1. 30-1. 44 (12H, m), 1. 58-1. 76 (4H, m), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 91-3. 08
(4H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 13-4. 40 (3H, m), 4. 87 (2H, s), 5. 52 (2H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 56 (1H, s),
15 7. 99 (1H, s), 8. 42-8. 60 (1H, m), 9. 31-9. 44 (1H, m), 9. 88-10. 02 (1H, m).

実施例 1075

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェニル
エステル; 臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 45 (9H, s), 2. 95 (4H, brs), 3. 79 (4H, br
s), 3. 84 (3H, s), 4. 121 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 80 (2H, s), 5. 51 (2H,
s), 7. 34 (1H, s), 7. 72 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 83 (1H, d, J=2. 0Hz).

MS: m/e (ESI) 592. 3 (MH⁺)

25 実施例 1076

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバ

モイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリノ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5] 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 1.45 (9H, s), 2.82 (3H, d, J=4.6Hz), 2.95 (4H, brs), 3.78 (4H, brs), 3.85 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.86 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.55 (1H, s), 7.73 (1H, d, J=2.0Hz), 7.84 (1H, d, J=2.0Hz), 8.21 (1H, q, J=4.6Hz), 8.56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 587.3 (MH⁺)

実施例 1077

10 1-[3-第3ブチル-5-(4-メタンスルフォニル-ピペラジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=7.0Hz), 2.95 (3H, s), 3.09 (4H, brs), 3.28 (4H, brs), 3.95 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, brs), 5.45 (2H, brs), 7.32 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.62 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 605.3 (MH⁺)

実施例 1078

20 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.0Hz), 2.95 (3H, s), 3.09 (4H, brs), 3.18 (4H, brs), 3.95 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=7.0Hz), 4.83 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.53 (1H, s), 7.63 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.0Hz), 8.54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 600.3 (MH⁺)

実施例 1079

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 20 (6H, d, J=7.2Hz), 1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 81 (3, d, J=4.0Hz), 2. 94-3. 08 (4H, m), 3. 68-3. 88 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 85 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 59 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4.0Hz), 8. 56 (1H, s).

実施例 1080

10 6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 20 (6H, d, J=6.4Hz), 2. 77 (3H, d, J=4.4Hz), 2. 91 (6H, s), 2. 90-3. 10 (5H, m), 3. 68-3. 92 (4H, m), 3. 87 (3H, s), 4. 74 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 7. 15 (2H, s), 7. 39 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 8. 07 (1H, s), 8. 37 (1H, q, J=4.4Hz), 8. 95 (1H, brs), 9. 54 (1H, brs).

実施例 1081

6-{2-[3-第3ブチル-5-((3R,4R)-3,4-ジヒドロ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4.8Hz), 2. 87-2. 98 (2H, m), 3. 50-3. 59 (2H, m), 3. 61 (3H, s), 4. 33-4. 43 (2H, m), 4. 24 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 87 (2H, s), 5. 40-5. 62 (2H, m), 7. 29 (1H, s), 7. 38 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 8. 45-8. 62 (1H, m), 9. 37 (1H, brs), 9. 94 (1H, brs).

25 実施例 1082

2,2-ジメチルプロピオン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-

イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェノキシメチル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 14 (9H, S), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 36 (9H, S), 1. 38-1. 42 (6H, m), 4. 08-4. 24 (6H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 5. 88 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 587. 4 (MH⁺)

実施例 1083

2,2-ジメチルプロピオン酸 2-第3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシメチル エステル;臭化水素酸塩

10

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 15 (9H, S), 1. 36 (9H, S), 1. 39-1. 43 (6H, m), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 4. 14 (2H, q, J=7. 0 Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 5. 88 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 55 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 54 (1H, s).

15

MS:m/e (ESI) 582. 4 (MH⁺)

実施例 1084

(4-{3-第3 ブチル-5-[2-5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-イル)-アセトニトリル;臭化水素酸塩

20

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 71 (4H, brs), 3. 06 (4H, brs), 3. 83 (2H, s), 3. 94 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 48 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 59 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 05 (1H, brs), 9. 27 (1H, brs).

25

MS:m/e (ESI) 566. 3 (MH⁺)

実施例 1085

2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-シアノメチルピペラジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 2.71 (4H, brs), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.05 (4H, brs), 3.82 (2H, s), 3.94 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=7.0Hz), 4.82 (2H, s), 5.46 (2H, s), 7.51 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.60 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.8Hz), 8.54 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 561.4 (MH⁺)

実施例 1086

- 10 {3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニルアミノ}-酢酸; 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.76 (3H, s), 3.92 (2H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.43 (2H, s), 6.99 (1H, s), 7.25 (1H, s), 7.33 (1H, s), 9.01 (1H, brs), 9.30 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 516.3 (MH⁺)

実施例 1087

- 20 2-(2-{3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.36 (9H, s), 2.75 (3H, d, J=4.0Hz), 2.81 (3H, s), 2.91 (6H, s), 3.17 (2H, t, J=5.6Hz), 3.52 (2H, t, J=5.4Hz), 4.73 (2H, s), 5.52 (2H, s), 7.15 (1H, s), 7.53 (1H, s), 8.10 (1H, s), 8.38 (1H, q, J=4.0Hz), 9.17 (1H, brs), 9.65 (1H, brs).

実施例 1088

2-(2-{3-第3ブチル-5-[(3-ヒドロキシプロピル)-メチルアミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 2塩酸塩

エニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 35 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 60 (2H, t, J=6. 4Hz), 2. 73 (3H, s), 2. 81 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 13 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 37 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 81 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 50 (2H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 22 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 52 (1H, s), 9. 25 (1H, brs), 9. 89 (1H, brs).

実施例 1089

10 1-{3-第3ブチル-5-[(3ヒドロキシプロピル)-メチルアミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 28 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 61 (2H, t, J=6. 4Hz), 2. 75 (3H, s), 3. 14 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 38 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 82 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 20 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 55 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 45 (1H, brs).

実施例 1090

20 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 77 (2H, t, J=6. 0Hz), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 19 (2H, t, J=6. 4Hz), 3. 40-3. 66 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 83 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 13 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 8. 20 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 36 (1H, brs), 9. 91 (1H, brs).

実施例 1091

1-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシプロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.36 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=6.8Hz), 1.77 (2H, t, J=6.4Hz), 3.07-3.24 (2H, m), 3.45-3.60 (2H, m), 3.73 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.22 (2H, q, J=6.8Hz), 4.60 (1H, t, J=4.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.37 (1H, t, J=4.0Hz), 5.47 (2H, s), 7.10 (1H, s), 7.22 (1H, s), 7.33 (1H, s), 9.03 (1H, brs), 9.32 (1H, brs).

実施例 1092

- 10 2-{2-[3-第3ブチル-5-(2-メタンсульフォニルアミノ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.35-1.42 (12H, m), 2.81 (3H, d, J=5Hz), 2.91 (3H, s), 3.15-3.30 (4H, m), 3.73 (3H, s), 4.27 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.53 (2H, s), 7.18 (1H, brs), 7.26 (1H, brs), 7.53 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=5Hz), 8.56 (1H, s), 9.36 (1H, brs), 9.91 (1H, brs).

実施例 1093

- 20 N-(2-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)]-アセチル]-2-メトキシ-フェニルアミノ}-エチル)-メタンсульフォンアミド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.35-1.42 (12H, m), 2.91 (3H, s), 3.15-3.30 (4H, m), 3.73 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q, J=7Hz), 4.79 (2H, s), 5.50 (2H, s), 7.17 (1H, brs), 7.25 (1H, brs), 7.27-7.35 (2H, m), 9.07 (1H, brs), 9.41 (1H, brs).

実施例 1094

{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-1-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニルアミノ}-酢酸;2塩酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 5 1.38(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.0Hz), 2.83(3H, d, J=4.6Hz), 3.76(3H, s), 3.93(2H, s), 4.28(2H, q, J=7.0Hz), 4.83(2H, s), 5.45(2H, s), 7.00(1H, d, J=2.0Hz), 7.27(1H, d, J=2.0Hz), 7.53(1H, s), 8.21(1H, q, J=4.6Hz), 8.55(1H, s), 9.21(1H, brd, J=5.2Hz), 9.83(1H, brd, J=6.4Hz).

MS:m/e(ESI) 511.3 (MH⁺)

10 実施例 1095

2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-メトキシ-エチルアミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 15 1.36(9H, s), 1.41(3H, t, J=7.2Hz), 2.82(3H, d, J=4.0Hz), 3.20-3.50(2H, m), 3.28(3H, s), 3.55(2H, t, J=6.0Hz), 3.72(3H, s), 4.27(2H, q, J=7.2Hz), 4.84(2H, s), 5.22(1H, t, J=6.0Hz), 5.47(2H, s), 7.17(1H, s), 7.25(1H, s), 7.54(1H, s), 8.20(1H, q, J=4.0Hz), 8.55(1H, s), 9.18(1H, brs), 9.82(1H, brs).

MS:m/e(ESI) 511.3 (MH⁺)

20 実施例 1096

1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-メトキシ-エチルアミノ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ :

- 25 1.29(3H, t, J=7.2Hz), 1.36(9H, s), 1.40(3H, t, J=7.2Hz), 3.25-3.41(2H, m), 3.54(2H, d, J=5.6Hz), 3.72(3H, s), 4.10(2H, q, J=7.2Hz), 4.20(2H, q, J=7.2Hz), 4.79(2H, s),

5. 22 (1H, t, J=4. 0Hz), 5. 46 (s, 2H), 7. 15 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 33 (s, 1H).

MS:m/e (ESI) 516. 3 (MH⁺)

実施例 1097

5 2-(2-{3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-(2-メトキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 81 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 15 (3H, s), 3. 28 (2H, t, J=6. 0Hz), 3. 26-3. 64 (6H, m), 3. 82 (3H, s), 4. 27 (3H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 52 (1H, s), 7. 60 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 4Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 36 (1H, s), 9. 92 (1H, s).

実施例 1098

15 1-{3-第3ブチル-5-[(2-ヒドロキシエチル)-(2-メトキシエチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 3. 15 (3H, s), 3. 28 (2H, t, J=6. 0Hz), 3. 20-3. 78 (4H, m), 3. 46 (2H, t, J=6. 0Hz), 3. 82 (3H, s), 4. 12 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 51 (1H, s), 7. 58 (1H, s), 9. 06 (1H, brs), 9. 39 (1H, brs).

実施例 1099

25 1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-2-オキシ-エトキシ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 3. 44-3. 62 (8H, m), 3. 97 (3H

, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.78 (2H, s), 5.02 (2H, s), 5.45 (2H, s), 7.33 (1H, s), 7.44 (1H, d, J=2.0Hz), 7.53 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 586.3 (MH⁺)

実施例 1100

- 5 2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-2-オキシ-エトキシ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.6Hz), 3.44-3.62 (8H, m), 3.97 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.02 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.45 (1H, s), 7.54 (2H, s), 8.20 (1H, q, J=4.6Hz), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 581.3 (MH⁺)

実施例 1101

- 15 1-[3-第3ブチル-5-((3R,4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.37 (9H, s), 1.39 (3H, t, J=7.2Hz), 2.91-2.99 (1H, m), 3.03-3.12 (1H, m), 3.30 (3H, s), 3.40-3.58 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.71-3.79 (1H, m), 4.10 (2H, q, J=7.2Hz), 4.10-4.30 (3H, m), 4.78 (2H, s), 5.25 (1H, brs), 5.38-5.60 (2H, m), 7.30 (1H, s), 7.33 (1H, s), 7.41 (1H, s), 8.99-9.12 (1H, m), 9.20-9.40 (1H, m).

MS:m/e (ESI) 558.3 (MH⁺)

実施例 1102

- 25 2-[2-(3-第3ブチル-5-シクロプロピルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.48-0.58 (2H, m), 0.72 (2H, m), 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 2.34-2.38 (1H, m),
 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 3.66 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.2Hz), 4.85 (2H, s), 5.48 (2H, s),
 5.83 (1H, s), 7.28 (1H, d, J=2.0Hz), 7.47 (1H, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, s), 8.20 (1H, d, J=

4.4Hz), 8.55 (1H, s), 9.18 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 493.3 (MH⁺)

実施例 1103

1-(3-第 3 ブチル-5-シクロプロピルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエ
トキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;

10 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.47-0.54 (2H, m), 0.72-0.80 (2H, m), 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t,
 J=7.2Hz), 2.32-2.38 (1H, m), 3.66 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.2Hz), 4.21 (2H, q, J=7.2Hz
), 4.79 (2H, s), 5.46 (2H, s), 5.82 (1H, s), 7.27 (1H, s), 7.33 (1H, s), 7.46 (1H, s).

15 MS:m/e (ESI) 498.3 (MH⁺)

実施例 1104

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シクロペンチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸
メチルアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.2Hz), 1.40-1.65 (6H, m), 1.86-2.02 (2H, m), 2.82 (3H, d,
 J=4.8Hz), 3.71 (3H, s), 3.62-3.82 (1H, s), 4.27 (2H, q, J=7.2Hz), 4.84 (2H, s), 5.05 (1
 H, d, J=6.4Hz), 5.47 (2H, s), 7.14 (1H, d, J=2.0Hz), 7.23 (1H, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, s)
 , 8.21 (1H, d, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s), 9.17 (1H, brs), 9.82 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 521.3 (MH⁺)

実施例 1105

1-(3-第3ブチル-5-シクロペンチルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 1.48-1.76 (6H, m), 1.90-2.02 (2H, m), 3.71 (3H, s), 3.72-3.84 (1H, m), 4.11 (2H, q, J=7.2Hz), 4.21 (2H, q, J=7.2Hz), 4.78 (2H, s), 5.04 (1H, d, J=6.4Hz), 5.45 (2H, s), 7.13 (1H, d, J=2.0Hz), 7.22 (1H, J=2.0Hz), 7.32 (1H, s).

実施例 1106

- 10 1-(3-アミノ-5-第3ブチル-4-メトキシフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1.38 (3H, t, J=7.2Hz), 1.43 (9H, s), 1.50 (3H, t, J=7.2Hz), 3.85 (3H, s), 4.17 (2H, q, J=7.2Hz), 4.24 (2H, q, J=7.2Hz), 4.82 (2H, s), 5.39 (2H, s), 7.19 (1H, s), 7.44 (1H, d, J=2.0Hz), 7.48 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 458.2 (MH⁺)

実施例 1107

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ニトロフェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

- 20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.6Hz), 1.40 (12H, s) and
 t, J=7.6Hz), 3.84 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.6Hz), 4.21 (2H, q, J=7.6Hz), 4.81 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.32 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=2.0Hz), 8.39 (1H, d, J=2.0Hz).

MS:m/e (ESI) 488.2 (MH⁺)

- 25 実施例 1108

2-[2-(3-第3ブチル-5-イソプロピルアミノ-4-メトキシフェニル)-2-オキソ-エ

チル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メ
チルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

5 1. 19 (6H, d, J=6. 0Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 60
-3. 78 (1H, m), 3. 71 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 83 (2H, s), 4. 90 (1H, d, J=6. 0Hz),
5. 46 (2H, s), 7. 14 (1H, s), 7. 22 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=4. 4Hz), 8. 55 (1H, s
).

実施例 1109

10 1-(3-第 3 ブチル-5-イソプロピルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエト
キシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭
化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1. 19 (6H, d, J=6. 4Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 3. 60
-3. 76 (1H, m), 3. 71 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 78 (2H, s),
4. 89 (1H, d, J=8. 4Hz), 5. 45 (2H, s), 7. 13 (1H, s), 7. 20 (1H, s), 7. 33 (1H, s).

実施例 1110

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-シクロブチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エ
チル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メ
チルアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 64-1. 80 (2H, m), 1. 87-2. 02 (2H, m), 2. 28-2. 40 (2H, m), 2. 82 (3H, d, J=6. 4Hz), 3. 73 (3H, s), 3. 84-3. 98 (1H, m), 4. 28 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 46 (2H, s), 5. 50 (1H, d, J=6. 0Hz), 7. 03 (1H, s), 7. 24 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 20 (1H, d, J=6. 4Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 81 (1H, brs).

25 実施例 1111

1-(3-第 3 ブチル-5-シクロブチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエト

キシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 60-1. 78 (2H, m), 1. 86-2. 02 (2H, m), 2. 37-2. 40 (2H, m), 3. 73 (3H, s), 3. 86-3. 97 (1H, m), 4. 11 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 45 (2H, s), 5. 49 (1H, s, J=6.0Hz), 7. 02 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 33 (1H, s).

実施例 1112

1-[3-(4-アセチル-ピペラジン-1-イル)-5-第 3 ブチル-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 2. 04 (3H, s), 2. 93 (2H, brs), 2. 99 (2H, brs), 3. 65 (4H, brs), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 49 (1H, sz), 7. 61 (1H, s), 9. 05 (1H, brs), 9. 27 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 569. 4 (MH⁺)

実施例 1113

イソプロピルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 13 (6H, d, J=6.4Hz), 1. 27-1. 34 (15H, m), 1. 40 (3H, t, J=7.0Hz), 3. 61-3. 70 (1H, m), 4. 07 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 12 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 55 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 78 (1H, d, J=8.0Hz), 9. 07 (1H, brd, J=6.8Hz), 9. 33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 1114

2-{2-[3-(4-アセチル-ピペラジン-1-イル)-5-第 3 ブチル 1-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
5 -5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 38 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 04 (3H, s), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 2. 93 (2H, brs)
, 3. 00 (2H, brs), 3. 65 (4H, brs), 3. 97 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 48
(2H, s), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 62 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 8H
10 z), 8. 56 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 564. 3 (MH⁺)

実施例 1115

イソプロピル-カルバミン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イ
ミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-
15 フェニルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 13 (6H, d, J=6. 4Hz), 1. 31 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 83
(3H, d, J=4. 6Hz), 3. 61-3. 68 (1H, m), 4. 07 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 8
6 (2H, s), 5. 51 (2H, s), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 57 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 78
20 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 6Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 21 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 553. 3 (MH⁺)

実施例 1116

1-[3-第 3 ブチル-5-((3S, 4S)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-
メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
25 ソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 2. 91-2. 99 (1H, m), 3. 03-3. 12 (1H, m), 3. 30 (3H, s), 3. 40-3. 58 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 71-3. 79 (1H, m), 4. 10 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 10-4. 30 (3H, m), 4. 78 (2H, s), 5. 38-5. 60 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 99-9. 12 (1H, m), 9. 20-9. 40 (1H, m).

5 MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 1117

ジメチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニルエステル;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (6H, t, J=7. 0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 92 (3H, s), 3. 09 (3H, s), 4. 08-4. 24 (6H, m), 4. 80 (2H, s), 5. 50 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 56 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 02 (1H, brs), 9. 33 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

15 実施例 1118

1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-2-オキソ-エチルアミノ)-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

20 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 38 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 3. 47-3. 63 (8H, m), 3. 77 (3H, s), 4. 02 (2H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 44 (2H, s), 7. 13 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 27 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 34 (1H, s), 9. 13 (1H, brs), 9. 31 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 585. 3 (MH⁺)

25 実施例 1119

ジメチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ

-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェ
ニルエステル;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 29 (3H, t, J=7.0Hz), 1. 34 (9H, s), 1. 42 (3H, t, J=7.0Hz), 2. 83 (3H, d, J=5.0Hz), 2. 93 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 3. 94-4. 02 (1H, m), 4. 12-4. 20 (1H, m), 4. 28 (2H, q, J=7.0Hz), 4. 86 (2H, s), 5. 53 (2H, s), 7. 52 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 55 (1H, s), 7. 58 (1H, d, J=2.0Hz), 8. 21 (1H, q, J=5.0Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 22 (1H, brs), 9. 86 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 539. 3 (MH⁺)

実施例 1120

- 10 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-メトキシ-1-メチル-エチルアミノ)-フェ
ニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドー
ル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 17 (3H, d, J=6.4Hz), 1. 41 (3H, t, J=7.2Hz), 2. 82 (3H, d, J=4.2Hz), 3. 27 (3H, s), 3. 37 -3. 48 (2H, m), 3. 71 (3H, s), 3. 71-3. 85 (1H, m), 4. 27 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 84 (2H, s), 4. 90 (1H, d, J=6.0Hz), 5. 46 (2H, s), 7. 18 (1H, s), 7. 23 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 20 (1H, s, J=4.2Hz), 8. 55 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 81 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 525. 3 (MH⁺)

実施例 1121

- 20 1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-メトキシ-1-メチル-エチルアミノ)-フェニ
ル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 17 (3H, d, J=6.4Hz), 1. 29 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7.2Hz), 3. 28 (3H, s), 3. 37-3. 48 (2H, m), 3. 71 (3H, s), 3. 62-3. 79 (1H, m), 4. 11 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 79 (2H, s), 4. 90 (1H, d, J=6.0Hz), 5. 46 (2H, s), 7. 17 (1H, d, J=2.0

Hz), 7.22 (1H, d, J=2.0Hz), 7.33 (1H, s), 9.03 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

実施例 1122

2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(テトラヒドロピラン-4-イルアミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.2Hz), 1.57-1.72 (2H, m), 2.08-2.21 (2H, m), 2.55-2.90 (5H, m), 3.72 (3H, s), 4.29 (2H, q, J=7.2Hz), 4.84 (2H, s), 5.11 (1H, d, J=6.0Hz), 5.46 (2H, s), 7.14 (1H, d, J=2.0Hz), 7.22 (1H, d, J=2.0Hz), 7.53 (1H, s), 8.20 (1H, q, J=4.2Hz), 8.55 (1H, s), 9.16 (1H, s), 9.82 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 553.3 (MH⁺)

実施例 1123

1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(テトラヒドロピラン-4-イルアミノ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.2Hz), 1.36 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.2Hz), 1.58-1.77 (2H, m), 2.08-2.20 (2H, m), 2.50-2.81 (5H, m), 3.72 (s, 3H), 4.11 (2H, q, J=7.2Hz), 4.21 (2H, q, J=7.2Hz), 4.78 (2H, s), 5.10 (1H, d, J=6.0Hz), 5.43 (2H, s), 7.13 (1H, s), 7.21 (1H, s), 7.33 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 558.3 (MH⁺)

実施例 1124

1-(3-第3ブチル-5-イソブチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.94 (6H, d, J=6.8Hz), 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 1.93-2.00 (1H, m), 2.90-2.93 (2H, m), 3.75 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.38 (1H, brs), 5.48 (2H, s), 7.06 (1H, s), 7.20 (1H, s), 7.33 (1H, s), 9.05 (1H, brs), 9.29 (1H, brs).

5 MS:m/e (ESI) 514.3 (MH⁺)

実施例 1125

2-[2-(3-第3ブチル-5-イソブチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.94 (6H, d, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 1.93-2.00 (1H, m), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 2.91-2.93 (2H, m), 3.75 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.38 (1H, t, J=6.0Hz), 5.46 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=2.0Hz), 7.22 (1H, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.15 (1H, d, J=5.8Hz), 9.82 (1H, d, J=5.8Hz).

15 MS:m/e (ESI) 509.3 (MH⁺)

実施例 1126

2-[2-(3-第3ブチル-5-イソブチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

0.94 (6H, d, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.93-2.00 (1H, m), 2.78 (3H, d, J=4.6Hz), 2.92 (8H, brs), 3.75 (3H, s), 4.73 (2H, s), 5.37 (1H, t, J=5.6Hz), 5.42 (2H, s), 7.07 (1H, s), 7.15 (1H, s), 7.21 (1H, s), 8.07 (1H, s), 8.37 (1H, q, J=4.6Hz), 8.91 (1H, brs), 9.51 (1H, brs).

25 MS:m/e (ESI) 508.3 (MH⁺)

実施例 1127

1-[3-第3ブチル-5-((3S, 4S)-3, 4-ジメトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 28 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=7. 2Hz), 3. 03-3. 16 (2H, m), 3. 29 (6H, s), 3. 36-3. 52 (2H, m), 3. 64 (3H, s), 3. 91 (2H, brs), 4. 11 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 21 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 36-5. 62 (2H, m), 7. 33 (2H, s), 7. 44 (1H, s), 8. 95-9. 35 (2H, m).

MS: m/e (ESI) 572. 4 (MH⁺)

10 実施例 1128

2-{2-[3-第3ブチル-5-((3S, 4S)-3, 4-ジメトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 79-2. 87 (3H, m), 3. 05-3. 15 (2H, m), 3. 29 (6H, s), 3. 38-3. 52 (2H, m), 3. 64 (3H, s), 3. 91 (2H, brs), 4. 27 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 40-5. 62 (2H, m), 7. 34 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 13-8. 30 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 05-9. 22 (1H, m), 9. 77-9. 92 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 567. 3 (MH⁺)

20 実施例 1129

2-{2-[3-第3ブチル-5-(2-シアノ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 33-1. 42 (12H, m), 2. 78-2. 88 (5H, m), 3. 45 (2H, m), 3. 75 (3H, s), 4. 27 (2H, q, J=7Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 5. 74 (1H, m), 7. 16 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 53 (1H, s), 8. 20 (1

H, q, J=5Hz), 8.55 (1H, s), 9.15 (1H, brs), 9.83 (1H, brs).

実施例 1130

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニルアミノ}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

5

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.33-1.42 (12H, m), 2.83 (2H, t, J=6Hz), 3.45 (2H, m), 3.75 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q, J=7Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 5.74 (1H, m), 7.15 (1H, brs), 7.27 (1H, brs), 7.33 (1H, brs), 9.04 (1H, brs), 9.29 (1H, brs).

10 実施例 1131

2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピペラジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 3.21 (4H, brs), 3.34 (2H, m), 3.41-3.48 (1H, m), 3.63-3.70 (1H, m), 3.94 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.57 (2H, s), 7.51 (1H, s), 7.54 (1H, s), 7.65 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.56 (1H, s), 9.12 (1H, brs), 9.18 (1H, brs), 9.32 (1H, brs), 9.90 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 522.3 (MH⁺)

20 実施例 1132

1-[3-第3ブチル-5-(4-イソプロピル-ピペラジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.22-1.38 (21H, m), 3.02-3.58 (8H, m), 3.94 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.80 (2H, s), 5.56 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.08 (1H, s)

brs), 9.43 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 569.4 (MH⁺)

実施例 1133

5 4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-カルボ
ン酸ジメチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.77 (6H, s), 2.99 (4H, brs),
10 , 3.37 (4H, brs), 3.95 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s),
, 5.48 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.52 (1H, s), 7.60 (1H, s), 9.05 (1H, brs), 9.27 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 598.3 (MH⁺)

実施例 1134

15 2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-ジメチルカルバモイル-ピペラジン-1-イル)-4-メト
キシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソ
インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.37 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.77 (6H, s), 2.83 (3H, d, J=5.2Hz), 3.00 (4H, brs),
, 3.31 (4H, brs), 3.95 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.53 (1
H, s), 7.54 (1H, s), 7.61 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=5.2Hz), 8.56 (1H, s).

20 MS:m/e (ESI) 593.4 (MH⁺)

実施例 1135

25 (4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-イ
ル)-酢酸;2塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.38 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 3.10-3.69 (10H, m), 3.93 (3

H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0Hz), 4.22 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 5.54 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.64 (1H, s), 9.10 (1H, brs), 9.40 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 585.3 (MH⁺)

実施例 1136

- 5 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-エチルアミノ)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 10 1.33-1.42 (12H, m), 2.40-2.60 (4H, m), 2.80-2.86 (5H, m), 3.20-3.36 (2H, m), 3.58 (4H, m), 3.75 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.15 (1H, brs), 7.25 (1H, brs), 7.54 (1H, s), 8.21 (1H, m), 8.56 (1H, s).

実施例 1137

- 15 1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-モルフォリノ-エチルアミノ)-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.33-1.42 (12H, m), 2.40-2.60 (4H, m), 3.20-3.40 (4H, m), 3.58 (4H, m), 3.74 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q, J=7Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.14 (1H, brs), 7.24 (1H, brs), 7.34 (1H, brs).

20 実施例 1138

- 1-{3-第 3 ブチル 1-5-[4-(2-ヒドロキシ-アセチル)-ピペラジン-1-イル]-4-メトキシ-フェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1.29 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.98 (4H, brs), 3.57 (2H, brs), 3.70 (2H, brs), 3.96 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7.0Hz), 4.12 (2H, s), 4.21 (2H, q, J=7.0

Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.49 (1H, d, J=2.0Hz), 7.61 (1H, d, J=2.0Hz), 9.05 (1H, brs), 9.27 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 585.3 (MH⁺)

実施例 1139

- 5 2-(2-{3-第3ブチル-5-[4-(2-ヒドロキシ-アセチル)-ピペラジン-1-イル]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

- 10 1.37 (9H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.8Hz), 2.98 (4H, brs), 3.57 (2H, brs), 3.69 (2H, brs), 3.97 (3H, s), 4.13 (2H, d, J=5.6Hz), 4.28 (2H, q, J=7.0Hz), 4.66 (1H, t, J=5.6Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.50 (1H, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, s), 7.62 (1H, d, J=2.0Hz), 8.21 (1H, q, J=4.8Hz), 8.55 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 580.3 (MH⁺)

実施例 1140

- 15 4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール 1-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-カルボン酸エチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ:

- 20 1.01 (3H, t, J=7.0Hz), 1.30 (3H, t, J=7.0Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0Hz), 2.93 (4H, brs), 3.02-3.08 (2H, m), 3.49 (4H, brs), 3.95 (3H, s), 4.12 (2H, q, J=7.0Hz), 4.22 (2H, q, J=7.0Hz), 4.79 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, s), 7.60 (1H, s).

MS:m/e (ESI) 598.3 (MH⁺)

実施例 1141

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-エチルカルバモイル-ピペラジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 01 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 83 (3H, d, J=4. 6Hz), 2. 93 (4H, brs), 3. 05 (2H, q, J=7. 0Hz), 3. 49 (4H, brs), 3. 95 (3H, s), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 6. 58 (1H, m), 7. 51 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 7. 61 (1H, s), 8. 21 (1H, q, J=4. 6Hz), 8. 56 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 85 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 593. 4 (MH⁺)

実施例 1142

(4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-イル-1)-酢酸エチルエステル; 2 塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 25 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 3. 02-3. 70 (10H, m), 3. 93 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 18-4. 25 (4H, m), 4. 28 (1H, brs), 4. 80 (2H, s), 5. 54 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 64 (1H, s), 9. 08 (1H, brs), 9. 37 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 613. 4 (MH⁺)

実施例 1143

1-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[4-(2 メトキシ-アセチル)-ピペラジン-1-イル]-フェニル}-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル 1)-エタノン; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 98 (4H, brs), 3. 29 (3H, s), 3. 61 (2H, brs), 3. 67 (2H, brs), 3. 96 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 12 (2H, s), 4. 21 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 50 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 61 (1H, d, J=2. 0Hz), 9. 03 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 599. 4 (MH⁺)

実施例 1144

2-{2-[3-第3ブチル-5-(2-メタンスルフォニル-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.30-1.44 (12H, m), 2.82 (3H, d, J=5Hz), 3.07 (3H, s), 3.47 (2H, m), 3.59 (2H, m), 3.74 (3H, s), 4.28 (2H, q, J=7Hz), 4.85 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.17 (1H, d, J=2Hz), 7.30 (1H, d, J=2Hz), 7.53 (1H, s), 8.21 (1H, q, J=5Hz), 8.55 (1H, s), 9.22 (1H, brs), 9.86 (1H, brs).

実施例 1145

10 1-[3-第3ブチル-5-(2-メタンスルフォニル-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

15 1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.35-1.42 (12H, m), 3.07 (3H, s), 3.45 (2H, m), 3.58 (2H, m), 3.73 (3H, s), 4.11 (2H, q, J=7Hz), 4.21 (2H, q, J=7Hz), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.16 (1H, d, J=2Hz), 7.29 (1H, d, J=2Hz), 7.33 (1H, brs), 9.06 (1H, brs), 9.31 (1H, brs).

実施例 1146

20 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[4-(2-メトキシ-アセチル)-ピペラジン-1-イル]-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

25 1.37 (9H, s), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz), 2.82 (3H, d, J=4.4Hz), 2.99 (4H, brs), 3.29 (3H, s), 3.61 (2H, brs), 3.67 (2H, brs), 3.97 (3H, s), 4.12 (2H, s), 4.27 (2H, q, J=7.0Hz), 4.84 (2H, s), 5.49 (2H, s), 7.51 (1H, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, s), 7.62 (1H, d, J=2.0Hz), 8.21 (1H, q, J=4.4Hz), 8.56 (1H, s), 9.16 (1H, brs), 9.85 (1H, brs).

MS: m/e (ESI) 594.4 (MH⁺)

実施例 1147

1-(4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-イル)-プロパン-1-オン;臭化水素酸塩

5 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.00 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1.29 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 2.36 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 2.94 (2H, brs), 2.98 (2H, brs), 3.66 (4H, brs), 3.96 (3H, s), 4.11 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4.21 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4.79 (2H, s), 5.47 (2H, s), 7.34 (1H, s), 7.50 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.61 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 9.06 (1H, brs), 9.28 (1H, brs).

10 MS: m/e (ESI) 583.4 (MH $^+$)

実施例 1148

2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(4-プロピオニル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1.00 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1.38 (9H, s), 1.42 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 2.36 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 2.83 (3H, d, $J=4.8\text{Hz}$), 2.94 (2H, brs), 2.99 (2H, brs), 3.66 (4H, brs), 3.97 (3H, s), 4.28 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 4.84 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.51 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 7.54 (1H, s), 7.62 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 8.21 (1H, q, $J=4.8\text{Hz}$), 8.56 (1H, s), 9.15 (1H, d, $J=5.6\text{Hz}$), 9.84 (1H, d, $J=5.6\text{Hz}$).

20

MS: m/e (ESI) 578.4 (MH $^+$)

実施例 1149

1-[3-第3ブチル-5-((3S,4S)-3-エトキシ-4-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;トリフルオロ酢酸塩

25

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ :

1. 10 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 29 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 39 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 90-3. 12 (2H, m), 3. 28-3. 58 (4H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 80-3. 89 (1H, m), 4. 11 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 12-4. 31 (3H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 38-5. 57 (2H, m), 7. 30 (1H, s), 7. 34 (1H, s), 7. 41 (1H, s), 8. 98-9. 10 (1H, m), 9. 20-9. 35 (1H, m).

5 MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH⁺)

実施例 1150

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-((3S, 4S)-3-エトキシ-4-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;トリフルオロ酢酸塩

10 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 10 (3H, t, J=6.8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=6.8Hz), 2. 83 (3H, d, J=4.4Hz), 2. 82-3. 12 (2H, m), 3. 34-3. 60 (4H, m), 3. 64 (3H, s), 3. 79-3. 92 (1H, m), 4. 10-4. 22 (1H, m), 4. 28 (2H, q, J=6.8Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 35-5. 60 (2H, m), 7. 32 (1H, s), 7. 42 (1H, s), 7. 54 (1H, s), 8. 14-8. 26 (1H, m), 8. 55 (1H, s), 9. 16 (1H, brs), 9. 84 (1H, brs).

15 MS:m/e (ESI) 567. 4 (MH⁺)

実施例 1151

1-{3-第 3 ブチル-5-[(3-エトキシ-イソキサゾール-5-イルメチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 24-1. 50 (6H, m), 1. 37 (9H, s), 3. 75 (3H, s), 4. 05-4. 16 (4H, m), 4. 20 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 43 (1H, d, J=6.0Hz), 4. 77 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 6. 04 (1H, s), 6. 13 (1H, t, J=6.0Hz), 7. 11 (1H, s), 7. 26 (1H, s), 7. 32 (1H, s), 9. 01 (1H, brs), 9. 28 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 583. 3 (MH⁺)

25 実施例 1152

1-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(3-メトキシ-イソキサゾール-5-イルメチル)-

アミノ}-フェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 29 (3H, t, J=7.2Hz), 1. 37 (s, 9H), 1. 39 (3H, t, J=7.2Hz), 3. 75 (3H, s), 3. 82 (3H, s), 4
5 . 11 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 20 (2H, q, J=7.2Hz), 4. 43 (2H, d, J=6.0Hz), 4. 78 (2H, s), 5. 41 (2H, s), 6. 05 (1H, s), 6. 14 (1H, s, J=7.2Hz), 7. 11 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 27 (1H, d, J=2.0Hz), 7. 32 (1H, s), 9. 02 (1H, brs), 9. 29 (1H, brs).

MS:m/e (ESI) 569. 3 (MH⁺)

実施例 1153

10 2-(2-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ}-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 37-1. 42 (12H, m), 2. 81 (3H, d, J=5Hz), 3. 82 (3H, s), 3. 92 (3H, s), 4. 26 (2H, q, J=7Hz)
15 , 4. 30 (2H, m), 4. 79 (2H, s), 5. 37 (2H, s), 6. 09 (1H, m), 6. 89-6. 95 (2H, m), 7. 24 (1H, d, J=2Hz), 7. 50-7. 55 (2H, m), 8. 03 (1H, m), 8. 19 (1H, m), 8. 53 (1H, s), 9. 11 (1H, brs), 9. 78 (1H, brs)

実施例 1154

20 1-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ}-フェニル}-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 28 (3H, t, J=7Hz), 1. 35-1. 43 (12H, m), 3. 82 (3H, s), 3. 93 (3H, s), 4. 11 (2H, q, J=7Hz)
25 , 4. 20 (2H, q, J=7Hz), 4. 30 (2H, m), 4. 73 (2H, s), 5. 35 (2H, s), 6. 09 (1H, m), 6. 89-6. 95 (2H, m), 7. 22 (1H, d, J=2Hz), 7. 30 (1H, brs), 7. 52 (1H, m), 8. 03 (1H, m)

実施例 1155

1-[3-第 3 ブチル-5-((3R, 4S)-3, 4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール 1-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 5 1. 29 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 37 (9H, s), 1. 40 (3H, t, J=6. 8Hz), 3. 02-3. 11 (2H, m), 3. 30-3. 54 (2H, m), 3. 60 (3H, s), 4. 00-4. 16 (4H, m), 4. 21 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 79 (2H, s), 5. 47 (2H, s), 7. 26 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 38 (1H, s), 9. 00-9. 08 (1H, m), 9. 23-9. 31 (1H, m).

MS: m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

実施例 1156

- 10 (4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル 1-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸エチルエステ; 臭化水素酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 15 1. 19 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 41 (3H, t, J=7. 0Hz), 2. 74 (4H, brs), 2. 83 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 01 (4H, brs), 3. 30 (2H, s), 3. 93 (3H, s), 4. 09 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 28 (2H, q, J=7. 0Hz), 4. 84 (2H, s), 5. 49 (2H, s), 7. 51 (1H, d, J=2. 0Hz), 7. 54 (1H, s), 7. 59 (1H, d, J=2. 0Hz), 8. 21 (1H, q, J=4. 8Hz), 8. 55 (1H, s).

MS: m/e (ESI) 608. 4 (MH⁺)

実施例 1157

- 20 2-(2-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(2-オキソ-1, 2-ジヒドロピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-フェニル}-2-オキソ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 メチルアミド; トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 25 1. 35-1. 45 (12H, m), 2. 82 (3H, d, J=5Hz), 3. 80 (3H, s), 4. 14 (2H, s), 4. 27 (2H, q, J=7Hz), 4. 81 (2H, s), 5. 39 (2H, s), 6. 15 (1H, m), 6. 97 (1H, brs), 7. 23-7. 29 (4H, m), 7. 51 (1H, brs), 8. 20 (1H, q,

J=5Hz), 8.53 (1H, brs), 9.15 (1H, brs), 9.80 (1H, brs)

MS:m/e (ESI) 559.2 (MH⁺)

実施例 1158

5 3-(3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニルアミノ}-メチル)-1H-
ピリジン-2-オン;トリフルオロ酢酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.28 (3H, t, J=7Hz), 1.35-1.42 (12H, m), 3.80 (3H, s), 4.10-4.23 (6H, m), 4.75 (2H, s),
 5.38 (2H, s), 6.14 (1H, m), 6.96 (1H, brs), 7.23 (1H, brs), 7.26-7.32 (4H, m), 9.00 (1H,
 10 brs), 9.28 (1H, brs)

MS:m/e (ESI) 565.3 (MH⁺)

実施例 1159

15 1-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz), 1.37 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 2.92 (2H, d, J=10Hz), 3.61 (3H, s),
 4.11 (2H, q, J=6.8Hz), 4.21 (2H, q, J=6.8Hz), 3.98-4.28 (4H, m), 4.78 (2H, s), 5.48 (2H, s),
 7.29 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.38 (1H, s), 9.04 (1H, brs), 9.29 (1H, brs)

20 実施例 1160

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-
フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=6.8Hz) 1.36 (9H, s) 1.39 (3H, t, J=6.8Hz) 2.94-3.08 (4H, m) 3.76-3.85 (4H, m)
 25 3.94 (3H, s) 4.11 (2H, q) 4.20 (2H, q, J=6.8Hz) 4.77 (2H, s) 5.49 (2H, s) 7.32 (1H, s) 7.49

(1H, s) 7.60 (1H, s)

- 以下の実施例化合物は、12mmΦ試験管中で少量多検体合成した。即ち2-イミノ-ジヒドロピロロ[3,4-b~e]ピリジンまたは1-イミノイソインドリン、2-イミノピロリジン、2-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イミダゾール、2-イミノ-2,3-ジヒドロ1H-ベンズ-[d]-イミダゾールの各種アミジン誘導体(5mg)のジメチルホルムアミド溶液(2ml)に各種2-ブロモ-1-エタノン誘導体(10mg)を加え室温で一晩攪拌した。反応終了後、窒素を吹き付けることにより溶媒を留去し残渣をLC-MS[展開溶媒：0.1%トリフルオロ酢酸含有アセトニトリル溶液：0.1%トリフルオロ酢酸含有水溶液=1:99~100:0/20分サイクル、流速：20ml/分、カラム：YMC Combiprep ODS-AM、20mmΦx50mm(Long)]により精製分離し、標記化合物を得た。

実施例 1161

- 7-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メチル-ベンゾフラン-3-カルボン酸；臭化水素酸塩
 15 MS:m/e (ESI) 434.0 (MH⁺)

実施例 1162

- 3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-安息香酸；臭化水素酸塩
 20 MS:m/e (ESI) 396.2 (MH⁺)

実施例 1163

- 3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-安息香酸；臭化水素酸塩
 25 MS:m/e (ESI) 410.3 (MH⁺)

実施例 1164

- 25 3-第 3 ブチル-2-カルボキシメトキシ-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-安息香酸メチルエステル；臭化水素

酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 3 (MH+)

実施例 1165

5 {3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 467. 4 (MH+)

実施例 1166

10 ((3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイル)-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水素

酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 4 (MH+)

実施例 1167

15 1-(2-第 3 ブチル-ピリジン-4-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 337. 4 (MH+)

実施例 1168

20 {2-第 3 ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-酢酸メチルエステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 454. 4 (MH+)

実施例 1169

25 {2-第 3 ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 410. 4 (MH+)

実施例 1170

{4-第 3 ブチル-2-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン

-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 410. 4 (MH+)

実施例 1171

- 5 3-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-プロピオン酸エチルエステル;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 452. 4 (MH+)

実施例 1172

- 10 N-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 429. 4 (MH+)

実施例 1173

- 15 3-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 408. 4 (MH+)

実施例 1174

- 20 3-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 424. 4 (MH+)

- 20 実施例 1175

{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 440. 4 (MH+)

実施例 1176

- 25 5-第3ブチル-7-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキサン-2-カルボン酸;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 438. 4 (MH+)

実施例 1177

5 1-(3, 5-Di-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジ
ヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 408. 5 (MH+)

実施例 1178

10 1-(7-エチル-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(2-エチル
-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸
塩

MS:m/e (ESI) 378. 4 (MH+)

実施例 1179

15 N-{5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-ア
セチル]-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-イル}-N-メチル-アセトア
ミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 421. 4 (MH+)

実施例 1180

20 N-{3-エチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン
-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-N-メチル-メタンスルホンアミ
ド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 431. 4 (MH+)

実施例 1181

25 1-(7-第 3 ブチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ
-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 378. 4 (MH+)

実施例 1182

7-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メチル-ベンゾフラン-3-カルボン酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 4 (MH⁺)

5 実施例 1183

3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 473. 4 (MH⁺)

実施例 1184

10 3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 487. 4 (MH⁺)

実施例 1185

15 {3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 5 (MH⁺)

実施例 1186

20 ((3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイル)-メチル-アミノ)-酢
酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 5 (MH⁺)

実施例 1187

25 1-(2-第 3 ブチル-ピリジン-4-イル)-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 413. 5 (MH⁺)

実施例 1188

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-酢酸メチルエステル;
臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 531.5 (MH⁺)

実施例 1189

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-プロピオン酸エチル
エステル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 529.4 (MH⁺)

実施例 1190

N-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メタン sulfon アミド;臭化水素
酸塩

15 MS:m/e (ESI) 506.4 (MH⁺)

実施例 1191

3-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 485.5 (MH⁺)

20 実施例 1192

3-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 501.5 (MH⁺)

実施例 1193

25 2-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486. 5 (MH+)

実施例 1194

1-(3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 517. 4 (MH+)

実施例 1195

1-(3,5-Di-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 485. 5 (MH+)

10 実施例 1196

2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(7-エチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 455. 4 (MH+)

15 実施例 1197

N-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-7-イル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498. 4 (MH+)

20 実施例 1198

N-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-エチル-2-ヒドロキシ-フェニル}-N-メチル-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 508. 4 (MH+)

25 実施例 1199

1-(7-第3ブチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フ

フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 455. 4 (MH⁺)

実施例 1200

- 5 {8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 5 (MH⁺)

実施例 1201

- 10 2-[2-(3,5-Di-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 480. 5 (MH⁺)

実施例 1202

- 15 6-エトキシ-2-[2-(7-エチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 450. 4 (MH⁺)

実施例 1203

- 20 2-{2-[7-(アセチル-メチル-アミノ)-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 4 (MH⁺)

実施例 1204

- 25 6-エトキシ-2-{2-[3-エチル-4-ヒドロキシ-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 503. 4 (MH+)

実施例 1205

- 5 2-[2-(7-第 3 ブチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 450. 4 (MH+)

実施例 1206

- 10 3-第 3 ブチル-2-エトキシ-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 423. 9 (MH+)

実施例 1207

- 15 3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-2-プロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 438. 2 (MH+)

実施例 1208

- 20 3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 438. 3 (MH+)

実施例 1209

- 1-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ
-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 396. 4 (MH+)

実施例 1210

- 25 {2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 454. 4 (MH+)

実施例 1211

1-(3-第 3 ブチル-5-ヒドロキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 382. 4 (MH+)

実施例 1212

4-{3-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-4-メチル-ペント-2-enoic acid エチル エステル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 420. 5 (MH+)

実施例 1213

2-{3-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-2-メチル-プロピオン酸 メチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 380. 4 (MH+)

15 実施例 1214

3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-プロピオン酸エチルエステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 466. 5 (MH+)

20 実施例 1215

3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 438. 5 (MH+)

実施例 1216

25 5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3, 3-ジメチル-1, 3-ジヒドロ-インドール-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 363. 4 (MH+)

実施例 1217

5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-1,3,3-トリメチル-1,3-ジヒドロ-インドール-2-オン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 377. 5 (MH+)

実施例 1218

{5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 421. 5 (MH+)

実施例 1219

1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 352. 5 (MH+)

15 実施例 1220

3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-エトキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 501. 5 (MH+)

実施例 1221

20 3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-プロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 515. 6 (MH+)

実施例 1222

25 3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 515. 6 (MH+)

実施例 1223

1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 473. 5 (MH⁺)

実施例 1224

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 531. 6 (MH⁺)

10 実施例 1225

1-(3-第3ブチル-5-ヒドロキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 459. 5 (MH⁺)

15 実施例 1226

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-プロピオン酸エチルエステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 543. 6 (MH⁺)

20 実施例 1227

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 515. 6 (MH⁺)

25 実施例 1228

5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-1,3-ジヒドロインドール-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 440.5 (MH⁺)

実施例 1229

5 5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-
イル)-アセチル]-1,3,3-トリメチル-1,3-ジヒドロインドール-2-オン;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 454.5 (MH⁺)

実施例 1230

10 {5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-
イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロインドール-1-イル}-酢
酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498.5 (MH⁺)

実施例 1231

15 1-(3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イ
ミノ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 429.5 (MH⁺)

実施例 1232

20 3-第3ブチル-2-エトキシ-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496.5 (MH⁺)

実施例 1233

25 3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-プロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510.5 (MH⁺)

実施例 1234

3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ

-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-安息香酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 5 (MH+)

実施例 1235

5 2-[2-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 5 (MH+)

実施例 1236

10 {2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 5 (MH+)

実施例 1237

15 {3-第 3 ブチル-2-エトキシ-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 5 (MH+)

実施例 1238

20 2-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 5 (MH+)

実施例 1239

25 1-(3-第 3 ブチル-4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-
ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 405. 5 (MH+)

実施例 1240

{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 409.4 (MH⁺)

実施例 1241

5 {4-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メチル-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 448.5 (MH⁺)

実施例 1242

10 {2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572.5 (MH⁺)

実施例 1243

15 {3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-エトキシ-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558.5 (MH⁺)

実施例 1244

20 2-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558.5 (MH⁺)

実施例 1245

25 {4-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メチル-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 525. 5 (MH+)

実施例 1246

1-(8-第 3 ブチル-4-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 498. 5 (MH+)

実施例 1247

1-(8-第 3 ブチル-4-プロピル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 512. 5 (MH+)

実施例 1248

{3-第 3 ブチル-2-エトキシ-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 525. 5 (MH+)

実施例 1249

2-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 525. 5 (MH+)

実施例 1250

1-(3-第 3 ブチル-4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 449. 5 (MH+)

実施例 1251

{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 453. 5 (MH⁺)

5 実施例 1252

{2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イ
ミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-
フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 5 (MH⁺)

10 実施例 1253

{3-第 3 ブチル-2-エトキシ-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイルアミノ}-酢酸;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553. 5 (MH⁺)

15 実施例 1254

2-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロ
ピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553. 5 (MH⁺)

20 実施例 1255

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エト
キシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 477. 5 (MH⁺)

25 実施例 1256

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド

ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 5 (MH⁺)

実施例 1257

5 {4-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メチル-ベンゾイミダゾール-1-イル)-
酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 520. 5 (MH⁺)

実施例 1258

10 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 5 (MH⁺)

実施例 1259

15 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-プロピル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イ
ル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 5 (MH⁺)

実施例 1260

20 2-アセチルアミノ-3-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピ
ロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-アクリル酸 メチル エステ
ル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 477. 2 (MH⁺)

実施例 1261

25 3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 2 (MH+)

実施例 1262

N-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-succinamic acid;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 465. 3 (MH+)

実施例 1263

8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 421. 4 (MH+)

10 実施例 1264

8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 407. 4 (MH+)

実施例 1265

15 1-(3-第3ブチル-4,5-ジメトキシ-フェニル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 396. 4 (MH+)

実施例 1266

20 1-(5-第3ブチル-フラン-3-yl)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 326. 4 (MH+)

実施例 1267

25 2-アセチルアミノ-3-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-プロピオン酸メチルエステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 479. 2 (MH+)

実施例 1268

2-アセチルアミノ-3-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アクリル酸メチル エステル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 554. 5 (MH⁺)

実施例 1269

3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 558. 5 (MH⁺)

実施例 1270

N-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-succinamic acid;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 542. 5 (MH⁺)

実施例 1271

8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 498. 4 (MH⁺)

実施例 1272

5-第 3 ブチル-7-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキサソ-2-カルボニル酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 515. 4 (MH⁺)

実施例 1273

1-(3-第3ブチル-4,5-ジメトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 473.4 (MH⁺)

実施例 1274

5 1-(5-第3ブチル-フラン-3-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 403.4 (MH⁺)

実施例 1275

10 2-アセチルアミノ-3-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-プロピオン酸メチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556.3 (MH⁺)

実施例 1276

15 2-アセチルアミノ-3-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アクリル酸メチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 549.2 (MH⁺)

実施例 1277

20 3-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-ベンゾイルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553.3 (MH⁺)

実施例 1278

25 N-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-succinamic acid;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 4 (MH⁺)

実施例 1279

2-[2-(8-第 3 ブチル-4-メチル-3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジ
ン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソイン
5 ドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 4 (MH⁺)

実施例 1280

2-[2-(8-第 3 ブチル-3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イ
ル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドル
10 -5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 479. 4 (MH⁺)

実施例 1281

2-[2-(4-アセチル-8-第 3 ブチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イ
ル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドル
15 -5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 4 (MH⁺)

実施例 1282

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-ニトロ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エ
トキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドル-5-酢酸メチルアミド;臭化水
20 素酸塩

MS:m/e (ESI) 469. 2 (MH⁺)

実施例 1283

5-第 3 ブチル-7-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]ジオキサン-2-カルボ
25 ン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 4 (MH⁺)

実施例 1284

2-[2-(3-第 3 ブチル-4,5-ジメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 454. 4 (MH⁺)

実施例 1285

2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(1,3,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 363. 4 (MH⁺)

実施例 1286

6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-1,4,4-トリメチル-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 391. 4 (MH⁺)

15 実施例 1287

1-[3-第 3 ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-フェニル]-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 434. 4 (MH⁺)

20 実施例 1288

2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(1,2,3,3-テトラメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 377. 4 (MH⁺)

25 実施例 1289

1-(7-第 3 ブチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-5-イ

ル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタ
ノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 422. 4 (MH⁺)

実施例 1290

- 5 1-(8-第 3 ブチル-4,4-ジメチル-チオクロマン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ
-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 436. 4 (MH⁺)

実施例 1291

- 10 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-(1,3,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 440. 5 (MH⁺)

実施例 1292

- 15 6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-アセチル]-1,4,4-トリメチル-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 5 (MH⁺)

実施例 1293

- 20 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-(1,2,3,3-テトラメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 454. 5 (MH⁺)

実施例 1294

- 25 1-(7-第 3 ブチル-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-5-イ
ル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 499. 5 (MH⁺)

実施例 1295

1-(8-第 3 ブチル-4, 4-ジメチル-チオクロマン-6-イル)-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸

5 塩

MS:m/e (ESI) 513. 5 (MH⁺)

実施例 1296

4-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン
10 -4-イル}-4-オキソ-ブタン酸 エチル エステル; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 593. 6 (MH⁺)

実施例 1297

2-[2-(7-第 3 ブチル-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[b]チオフェン-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール
15 -5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 494. 5 (MH⁺)

実施例 1298

{2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノ
20 キシ}-酢酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 5 (MH⁺)

実施例 1299

2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(1, 3, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル)-エタノン; 臭化
25 水素酸塩

MS:m/e (ESI) 412. 4 (MH⁺)

実施例 1300

1-[3-第3ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメトキシ)-フェニル]-2-(7-フルオ
ロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 483.4 (MH⁺)

実施例 1301

{2-[(アセチル-メチル-アミノ)-メチル]-6-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-7-フ
ルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチ
ル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 558.5 (MH⁺)

実施例 1302

(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-酢酸;臭
化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 481.1 (MH⁺)

実施例 1303

{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 439.1 (MH⁺)

20 実施例 1304

4-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 454.2 (MH⁺)

実施例 1305

25 4-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 453. 2 (MH+)

実施例 1306

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 468. 3 (MH+)

実施例 1307

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 467. 4 (MH+)

10 実施例 1308

1-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-1,1-ジオキソ-1 λ 6*-チオクロマン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 4 (MH+)

15 実施例 1309

1-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-クロマン-6-イル)-2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 420. 4 (MH+)

実施例 1310

20 {2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 394. 4 (MH+)

実施例 1311

25 {2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-チオフェン-2-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 492. 4 (MH+)

実施例 1312

2-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 424. 4 (MH⁺)

5 実施例 1313

[2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 517. 4 (MH⁺)

10 実施例 1314

(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553. 5 (MH⁺)

15 実施例 1315

{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 5 (MH⁺)

20 実施例 1316

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 5 (MH⁺)

25 実施例 1317

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニ

ル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 525. 5 (MH+)

実施例 1318

- 5 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 5 (MH+)

実施例 1319

- 10 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539. 5 (MH+)

実施例 1320

- 15 2-[2-(8-第 3 ブチル-4,4-ジメチル-1,1-ジオキソ-11 λ 6*-チオクロマン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 5 (MH+)

実施例 1321

- 20 2-[2-(8-第 3 ブチル-4,4-ジメチル-クロマン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 492. 5 (MH+)

実施例 1322

- 25 {2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 466. 4 (MH+)

実施例 1323

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-チオフェン-2-イル-フェノキシ}-酢

5 酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 564. 5 (MH+)

実施例 1324

[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メタンスルフォニル-メチル-アミ

10 ノ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 589. 5 (MH+)

実施例 1325

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水

15 素酸塩

MS:m/e (ESI) 512. 5 (MH+)

実施例 1326

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール

20 -5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 5 (MH+)

実施例 1327

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素

25 酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 4 (MH+)

実施例 1328

2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 525. 4 (MH⁺)

実施例 1329

2-[2-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-1,1-ジオキシ-11 λ 6*-チオクロマン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 526. 2 (MH⁺)

実施例 1330

2-[2-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-クロマン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 478. 4 (MH⁺)

実施例 1331

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 531. 4 (MH⁺)

実施例 1332

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 530. 4 (MH⁺)

実施例 1333

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 545.4 (MH⁺)

5 実施例 1334

4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544.4 (MH⁺)

10 実施例 1335

1-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-1,1-ジオキソ-11 λ *6*-チオクロマン-6-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 545.4 (MH⁺)

15 実施例 1336

1-(8-第3ブチル-4,4-ジメチル-クロマン-6-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 497.4 (MH⁺)

実施例 1337

20 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 471.4 (MH⁺)

実施例 1338

25 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-チオフェン-2-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 569. 3 (MH⁺)

実施例 1339

2-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 501. 4 (MH⁺)

実施例 1340

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 594. 4 (MH⁺)

実施例 1341

{6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 512. 3 (MH⁺)

実施例 1342

(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 530. 4 (MH⁺)

実施例 1343

{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 488. 3 (MH⁺)

実施例 1344

{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 443. 3 (MH⁺)

実施例 1345

- 5 {2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-チオフェン-2-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 541. 4 (MH⁺)

実施例 1346

- 10 2-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 473. 3 (MH⁺)

実施例 1347

- 15 {6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-
酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 484. 3 (MH⁺)

実施例 1348

- 20 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 530. 1 (MH⁺)

実施例 1349

- 25 {2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 2 (MH+)

実施例 1350

{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-

5 酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539. 3 (MH+)

実施例 1351

{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-プロポキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;

10 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539. 3 (MH+)

実施例 1352

{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭

15 化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 4 (MH+)

実施例 1353

{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭

20 化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 525. 4 (MH+)

実施例 1354

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素

25 酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH+)

実施例 1355

{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 539. 4 (MH⁺)

実施例 1356

{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 567. 5 (MH⁺)

実施例 1357

{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-プロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 567. 5 (MH⁺)

実施例 1358

{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 539. 5 (MH⁺)

実施例 1359

(アセチル-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 528. 5 (MH⁺)

実施例 1360

(アセチル- {2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2,4-ジメチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 5 (MH+)

5 実施例 1361

(アセチル- {2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509. 5 (MH+)

10 実施例 1362

(アセチル- {2-第 3 ブチル-4-[2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 5 (MH+)

15 実施例 1363

(アセチル- {2-第 3 ブチル-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-プロポキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 5 (MH+)

20 実施例 1364

(アセチル- {2-第 3 ブチル-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509. 5 (MH+)

25 実施例 1365

({2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 500. 5 (MH+)

実施例 1366

- 5 ({2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2, 4-ジメチル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 467. 5 (MH+)

実施例 1367

- 10 ({2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 5 (MH+)

実施例 1368

- 15 ({2-第 3 ブチル-4-[2-(1-イミノ-5-イソプロポキシ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509. 5 (MH+)

実施例 1369

- 20 ({2-第 3 ブチル-4-[2-(1-イミノ-6-メチルカルバモイル-5-プロポキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509. 5 (MH+)

実施例 1370

- 25 ({2-第 3 ブチル-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-酢酸;臭化水

素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 5 (MH+)

実施例 1371

5 1-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-イソプロポキシ-フェニル)-2-(5, 6-ジエチキ
シ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 487. 5 (MH+)

実施例 1372

10 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-イソプロポキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸 アミ
ド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 5 (MH+)

実施例 1373

15 7-第 3 ブチル-9-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[e]アズレン-4-オン; 臭化水素酸
塩

MS:m/e (ESI) 457. 4 (MH+)

実施例 1374

20 {8-第 3 ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-
酢酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 465. 4 (MH+)

実施例 1375

25 3-{8-第 3 ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イル}-プロピオ
ン酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 465. 4 (MH⁺)

実施例 1376

2-{8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 465. 4 (MH⁺)

実施例 1377

2-{8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 479. 5 (MH⁺)

実施例 1378

2-[2-(7-第3ブチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[e]アズレン-9-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 529. 5 (MH⁺)

実施例 1379

{8-第3ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 537. 5 (MH⁺)

実施例 1380

3-{8-第3ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 537. 5 (MH⁺)

実施例 1381

7-第 3 ブチル-9-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[e]アズレン-4-オン;
臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 534. 5 (MH⁺)

実施例 1382

7-第 3 ブチル-9-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[e]アズレン-4-オン;
臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 542. 5 (MH⁺)

実施例 1383

3-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イ
ル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 542. 5 (MH⁺)

実施例 1384

7-第 3 ブチル-9-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-オキサ-10b-アザ-ベンゾ[e]アズレン-4-オン;
臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 506. 4 (MH⁺)

実施例 1385

{8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン
-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 514. 4 (MH⁺)

実施例 1386

3-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514.4 (MH⁺)

5 実施例 1387

3-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 453.4 (MH⁺)

10 実施例 1388

3-(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495.4 (MH⁺)

15 実施例 1389

{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 453.4 (MH⁺)

実施例 1390

20 4-{8-第3ブチル-6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 479.4 (MH⁺)

実施例 1391

25 4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸

塩

MS:m/e (ESI) 507. 5 (MH+)

実施例 1392

5 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 5 (MH+)

実施例 1393

10 [2-第 3 ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 4 (MH+)

実施例 1394

15 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン
酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 519. 5 (MH+)

実施例 1395

20 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 533. 5 (MH+)

実施例 1396

25 3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミ
ノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524. 2 (MH⁺)

実施例 1397

- 5 3-(アセチル-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 5 (MH⁺)

実施例 1398

- 10 {2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524. 4 (MH⁺)

実施例 1399

- 15 4-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 550. 5 (MH⁺)

実施例 1400

- 20 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 578. 5 (MH⁺)

実施例 1401

- 25 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 592. 6 (MH⁺)

実施例 1402

[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 564. 5 (MH⁺)

実施例 1403

{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 524. 5 (MH⁺)

実施例 1404

3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 525. 5 (MH⁺)

実施例 1405

3-(アセチル-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 567. 5 (MH⁺)

実施例 1406

[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチル-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 525. 5 (MH⁺)

実施例 1407

4-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551.5 (MH⁺)

5 実施例 1408

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565.5 (MH⁺)

10 実施例 1409

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 579.5 (MH⁺)

15 実施例 1410

[2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551.4 (MH⁺)

20 実施例 1411

3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 530.5 (MH⁺)

25 実施例 1412

3-(アセチル-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-

ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 5 (MH⁺)

実施例 1413

- 5 {2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 530. 5 (MH⁺)

実施例 1414

- 10 4-{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556. 5 (MH⁺)

実施例 1415

- 15 3-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジルアミノ}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502. 4 (MH⁺)

実施例 1416

- 20 3-(アセチル-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-アミノ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH⁺)

実施例 1417

- 25 {2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メチルアミノメチル-フェノキシ}-酢酸;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502. 4 (MH+)

実施例 1418

5 4-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 4 (MH+)

実施例 1419

10 4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556. 4 (MH+)

実施例 1420

15 5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 5 (MH+)

実施例 1421

20 [2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 4 (MH+)

実施例 1422

25 [2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 4 (MH+)

実施例 1423

[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-
5 フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 4 (MH+)

実施例 1424

[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-
10 ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-
イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 5 (MH+)

実施例 1425

[2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
15 インドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH+)

実施例 1426

[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソ
20 インドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH+)

実施例 1427

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
25 [3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イ
ルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 1 (MH+)

実施例 1428

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 567. 2 (MH⁺)

実施例 1429

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 566. 3 (MH⁺)

実施例 1430

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 1431

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

実施例 1432

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 505. 4 (MH⁺)

実施例 1433

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565. 4 (MH⁺)

5 実施例 1434

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 564. 4 (MH⁺)

10 実施例 1435

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 4 (MH⁺)

15 実施例 1436

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-5-オキソ-ピロリジン-2-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 4 (MH⁺)

20 実施例 1437

{2-シクロペンチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 499. 3 (MH⁺)

実施例 1438

25 {2-シクロペンチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 434. 3 (MH⁺)

実施例 1439

1-(7-第 3 ブチル-2-メチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素

5 酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 4 (MH⁺)

実施例 1440

1-(7-第 3 ブチル-2-メチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸

10 塩

MS:m/e (ESI) 403. 4 (MH⁺)

実施例 1441

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブ

15 タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539. 5 (MH⁺)

実施例 1442

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水

20 素酸塩

MS:m/e (ESI) 480. 4 (MH⁺)

実施例 1443

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール

25 -5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 538. 5 (MH⁺)

実施例 1444

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 479.5 (MH⁺)

実施例 1445

{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 553.5 (MH⁺)

実施例 1446

{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 507.5 (MH⁺)

実施例 1447

2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 580.6 (MH⁺)

実施例 1448

4-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 424.1 (MH⁺)

25 実施例 1449

4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(6-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 2 (MH+)

実施例 1450

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

5 イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 3 (MH+)

実施例 1451

4-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 454. 3 (MH+)

実施例 1452

4-{3-第3ブチル-5-[2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 442. 3 (MH+)

15 実施例 1453

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソイ
ンドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 486. 4 (MH+)

20 実施例 1454

4-{3-第3ブチル-5-[2-(1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセ
チル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 438. 4 (MH+)

実施例 1455

25 4-{3-第3ブチル-5-[2-(6-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 482. 5 (MH+)

実施例 1456

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 482. 5 (MH+)

実施例 1457

4-{3-第3ブチル-5-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 4 (MH+)

10 実施例 1458

4-{3-第3ブチル-5-[2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 456. 4 (MH+)

実施例 1459

15 4-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 500. 5 (MH+)

実施例 1460

20 [2-第3ブチル-4-[2-(6-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH+)

実施例 1461

25 [2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水

素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH+)

実施例 1462

5 {2-第3ブチル-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水

素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 4 (MH+)

実施例 1463

10 [2-第3ブチル-4-[2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水

素酸塩

MS:m/e (ESI) 484. 3 (MH+)

実施例 1464

15 [2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-

酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 3 (MH+)

実施例 1465

20 (1-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 466. 4 (MH+)

実施例 1466

25 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(6-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;

臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH+)

実施例 1467

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;
臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH+)

実施例 1468

(1-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;
臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 496. 4 (MH+)

実施例 1469

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(6-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;
臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 484. 4 (MH+)

実施例 1470

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;
臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 528. 3 (MH+)

実施例 1471

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-メトキシカルボニル-アミノ)-酢酸;
臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 569. 5 (MH+)

実施例 1472

({3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-メトキシカルボニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 568.5 (MH⁺)

5 実施例 1473

({3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-メトキシカルボニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 574.4 (MH⁺)

10 実施例 1474

({3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-メトキシカルボニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 546.3 (MH⁺)

15 実施例 1475

({3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-メタンスルフォニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 517.3 (MH⁺)

20 実施例 1476

({3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソオンドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-メタンスルフォニルアミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 589.4 (MH⁺)

25 実施例 1477

({3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-

ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-メタン
スルフォニル-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 588. 4 (MH+)

実施例 1478

- 5 (({3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-メタンスルフォニル
-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 594. 5 (MH+)

実施例 1479

- 10 (({3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-ベンジル}-メタンスルフォニル
-アミノ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 4 (MH+)

実施例 1480

- 15 {2-第 3 ブチル-6-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5, 7-
ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 4 (MH+)

実施例 1481

- 20 {2-第 3 ブチル-6-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-
メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノ
キシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 583. 5 (MH+)

実施例 1482

- 25 {2-第 3 ブチル-6-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フル
オロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-

酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 588. 5 (MH+)

実施例 1483

5 (1-{3-第 3 ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-

酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 4 (MH+)

実施例 1484

10 {2-第 3 ブチル-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-イミノ-2-メチル
-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;

臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 4 (MH+)

実施例 1485

15 {2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 439. 4 (MH+)

実施例 1486

20 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリ
ジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-

酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 3 (MH+)

実施例 1487

25 [2-第 3 ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-6-イル)-アセチル]-6-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;

臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 4 (MH+)

実施例 1488

{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-4,4a,5,7-テトラヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 453.4 (MH⁺)

実施例 1489

4-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 553.2 (MH⁺)

実施例 1490

6-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ヘキササン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 581.5 (MH⁺)

実施例 1491

{2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 611.5 (MH⁺)

実施例 1492

4-{2-アセチルアミノ-6-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 567.5 (MH⁺)

実施例 1493

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-(8-イソプロピル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ
[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 465.4 (MH⁺)

5 実施例 1494

{6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイン
ドール-2-イル)-アセチル]-8-イソプロピル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン
-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509.3 (MH⁺)

10 実施例 1495

4-{6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイン
ドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン
-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535.4 (MH⁺)

15 実施例 1496

4-{2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ブタン酸;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539.3 (MH⁺)

20 実施例 1497

6-{2-第3ブチル-4-[2-(6-カルバモイル-5-エトキシ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ヘキサン酸;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567.5 (MH⁺)

25 実施例 1498

4-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-

メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 571.3 (MH⁺)

実施例 1499

- 5 6-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ヘキサン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 599.5 (MH⁺)

実施例 1500

- 10 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 585.5 (MH⁺)

実施例 1501

- 15 4-{6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 534.4 (MH⁺)

実施例 1502

- 20 4-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558.4 (MH⁺)

実施例 1503

- 25 6-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ヘキサン酸;

臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586. 5 (MH+)

実施例 1504

5 {2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フル
オロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-
酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 616. 5 (MH+)

実施例 1505

10 4-{2-アセチルアミノ-6-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミ
ノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 5 (MH+)

実施例 1506

15 2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-(8-イソプロピル-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 470. 4 (MH+)

実施例 1507

20 {6-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-アセチル]-8-イソプロピル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イ
ル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH+)

実施例 1508

25 (4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチ
ル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 597. 5 (MH+)

実施例 1509

4-{6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 540. 4 (MH+)

実施例 1510

4-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 530. 4 (MH+)

実施例 1511

6-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ヘキサン酸;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 558. 5 (MH+)

実施例 1512

{2-(4-アセチルアミノ-プトキシ)-6-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 588. 5 (MH+)

実施例 1513

4-{2-アセチルアミノ-6-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH+)

実施例 1514

2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(8-イソプロピル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 442.4 (MH⁺)

実施例 1515

{6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-8-イソプロピル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 486.3 (MH⁺)

実施例 1516

(4-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 569.5 (MH⁺)

実施例 1517

4-{6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 512.4 (MH⁺)

実施例 1518

{2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 539.5 (MH⁺)

実施例 1519

4-{2-アセチルアミノ-6-第3ブチル-4-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495.4 (MH⁺)

実施例 1520

- 5 2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(8-イソプロピル-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 393.4 (MH⁺)

実施例 1521

- 10 {6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-8-イソプロピル-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 437.3 (MH⁺)

実施例 1522

- 15 (4-{3-第3ブチル-5-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 520.5 (MH⁺)

実施例 1523

- 20 4-{6-[2-(2-エチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4,4-ジメチル-2-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 463.4 (MH⁺)

実施例 1524

- 25 {2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢

酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551. 5 (MH+)

実施例 1525

- 5 4-{2-アセチルアミノ-6-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジ
ヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 4 (MH+)

実施例 1526

- 10 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イ
ル)-1-(8-イソプロピル-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ [1, 4] オキサジン-6-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 405. 4 (MH+)

実施例 1527

- 15 {6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イ
ル)-アセチル]-8-イソプロピル-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] オキサジン-4-イル}-
酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 449. 3 (MH+)

実施例 1528

- 20 (4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチ
ル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 532. 5 (MH+)

実施例 1529

- 25 4-{6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-
イル)-アセチル]-4, 4-ジメチル-2-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル}-
ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 475. 4 (MH⁺)

実施例 1530

[4-(3-第 3 ブチル-5-{2-[5-エトキシ-1-イミノ-6-(1-メトキシ-プロピル)-1,3-

5 ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-アセチル}-ベンジル)-ピペラジン-1-イル]-

MS:m/e (ESI) 607. 6 (MH⁺)

実施例 1531

(2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-{2-[5-エトキシ-1-イミノ-6-(1-メトキシ-

10 プロピル)-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル]-アセチル}-フェノキシ)-酢

MS:m/e (ESI) 540. 4 (MH⁺)

実施例 1532

(4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(6-第 3 ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール

15 -2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペラジン-1-イル)-酢酸 エチル エステル;臭

MS:m/e (ESI) 547. 2 (MH⁺)

実施例 1533

{2-第 3 ブチル-4-[2-(6-第 3 ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

20 イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 480. 4 (MH⁺)

{2-(4-アセチルアミノ-ブトキシ)-6-第 3 ブチル-4-[2-(6-第 3 ブチル-1-イミノ

25 -1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素

MS:m/e (ESI) 566. 5 (MH⁺)

実施例 1535

{2-第3ブチル-4-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506. 5 (MH⁺)

実施例 1536

- 5 4-{3-第3ブチル-5-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 494. 5 (MH⁺)

実施例 1537

- 10 4-{3-第3ブチル-5-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 480. 5 (MH⁺)

実施例 1538

- 15 4-{2-第3ブチル-4-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 494. 3 (MH⁺)

実施例 1539

{2-第3ブチル-4-[2-(6-第3ブチル-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522. 3 (MH⁺)

- 20 実施例 1540

4-{3-第3ブチル-2-ヒドロキシ-5-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 439. 4 (MH⁺)

実施例 1541

- 25 {2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イルメチル-フェノキシ}-酢酸;臭

化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 1 (MH+)

実施例 1542

5 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-カル
ボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 491. 2 (MH+)

実施例 1543

10 4-{2-アセチルアミノ-6-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジ
ヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506. 2 (MH+)

実施例 1544

15 5-{2-アセチルアミノ-6-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジ
ヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH+)

実施例 1545

20 1-{3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-[3-(2-メトキシ-エトキシ)-プロポキシ]-フェ
ニル}-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 3 (MH+)

実施例 1546

25 4-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチロニチリ
ル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 447. 3 (MH⁺)

実施例 1547

3-{7-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンゾオキサゾール-2-イル}-プロピオン

5 酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 461. 3 (MH⁺)

実施例 1548

{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イルメチル-フェノキ

10 シ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565. 4 (MH⁺)

実施例 1549

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-

15 カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551. 3 (MH⁺)

実施例 1550

2-{2-[3-アセチルアミノ-5-第 3 ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

20 -5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 4 (MH⁺)

実施例 1551

5-{2-アセチルアミノ-6-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカル
バモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン

25 タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 581. 4 (MH⁺)

実施例 1552

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イルメチル-フェノキシ}-酢酸;
臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 570. 4 (MH⁺)

実施例 1553

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-カルボ
ン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 556. 3 (MH⁺)

実施例 1554

1-{3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-[3-(2-メトキシ-エトキシ)-プロポキシ]-フェ
ニル}-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 561. 4 (MH⁺)

実施例 1555

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチロニチリル;
臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 512. 3 (MH⁺)

実施例 1556

3-{7-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾオキサゾール-2-イル}-プロピオン酸;
臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 526. 3 (MH⁺)

実施例 1557

4-{2-アセチルアミノ-6-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 543. 3 (MH⁺)

5 実施例 1558

5-{2-アセチルアミノ-6-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH⁺)

10 実施例 1559

(1-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 451. 3 (MH⁺)

15 実施例 1560

(1-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 4 (MH⁺)

20 実施例 1561

(1-{5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 488. 3 (MH⁺)

25 実施例 1562

(1-{3-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイン

ドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 4 (MH⁺)

実施例 1563

- 5 {4-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506. 4 (MH⁺)

実施例 1564

- 10 {4-第 3 ブチル-6-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-ベンゾイミダゾール-1-イル}-酢酸;臭化水素酸
塩

MS:m/e (ESI) 511. 3 (MH⁺)

実施例 1565

- 15 [4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イ
ル)-アセチル]-2-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 451. 2 (MH⁺)

実施例 1566

- 20 [4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインド
ール-2-イル)-アセチル]-2-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢
酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 3 (MH⁺)

実施例 1567

- 25 [4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-アセチル]-2-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 488. 3 (MH+)

実施例 1568

5 1-(3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル)-ピロリジン-2-イ
ル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 4 (MH+)

実施例 1569

10 1-(7-第 3 ブチル-3-メチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-(2-シクロプロピ
ル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 402. 3 (MH+)

実施例 1570

15 1-(7-第 3 ブチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミ
ノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 388. 3 (MH+)

実施例 1571

20 1-[3-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェニル]-2-(2-シ
クロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノ
ン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 452. 4 (MH+)

実施例 1572

25 [2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェノキシ]-酢酸;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH+)

実施例 1573

1-(3-第3ブチル-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 348.4 (MH⁺)

5 実施例 1574

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565.4 (MH⁺)

10 実施例 1575

2-[2-(7-第3ブチル-3-メチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 462.4 (MH⁺)

15 実施例 1576

2-[2-(7-第3ブチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 448.0 (MH⁺)

20 実施例 1577

2-{2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 512.2 (MH⁺)

25 実施例 1578

[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド

ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-プトキシ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 3 (MH+)

実施例 1579

- 5 2-{2-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-プトキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 3 (MH+)

実施例 1580

- 10 [2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-プトキシ)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 569. 3 (MH+)

実施例 1581

- 15 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 3 (MH+)

実施例 1582

- 20 1-(7-第3ブチル-3-メチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 467. 3 (MH+)

実施例 1583

- 25 1-(7-第3ブチル-3H-ベンズイミダゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 453. 3 (MH⁺)

実施例 1584

1-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタ
5 ノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 517. 4 (MH⁺)

実施例 1585

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
10 インドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェノキシ]-酢酸;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 575. 4 (MH⁺)

実施例 1586

1-(3-第3ブチル-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒ
15 ドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 413. 4 (MH⁺)

実施例 1587

1-[3-第3ブチル-4-ヒドロキシ-5-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェニル]-2-(7-フ
20 ルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタ
ノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 489. 4 (MH⁺)

実施例 1588

[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
25 インドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ブトキシ)-フェノキシ]-酢酸;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547. 4 (MH⁺)

実施例 1589

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507.5 (MH⁺)

5. 実施例 1590

1-(7-第3ブチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 389.3 (MH⁺)

実施例 1591

10 4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 431.3 (MH⁺)

実施例 1592

15 (1-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-エチル-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 479.3 (MH⁺)

実施例 1593

20 (1-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-3-イソプロピル-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493.3 (MH⁺)

実施例 1594

25 [2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-

酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 4 (MH+)

実施例 1595

- 5 [2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-

酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535. 4 (MH+)

実施例 1596

- 10 1-(7-第 3 ブチル-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ
-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 454. 3 (MH+)

実施例 1597

- 15 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩
MS:m/e (ESI) 496. 4 (MH+)

実施例 1598

- 20 (1-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-アセチル]-3-エチル-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキ
シ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH+)

実施例 1599

- 25 (1-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-3-イソプロピル-フェニル}-ピロリジン-3-イ
ルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH+)

実施例 1600

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586.4 (MH⁺)

5 実施例 1601

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 600.5 (MH⁺)

10 実施例 1602

(1-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-エチル-2-ヒドロキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539.4 (MH⁺)

15 実施例 1603

(1-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-3-イソプロピル-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553.4 (MH⁺)

20 実施例 1604

[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595.5 (MH⁺)

25 実施例 1605

[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ

インドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH+)

実施例 1606

- 5 {2-第3ブチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH+)

実施例 1607

- 10 4-(3-第3ブチル-5-{2-[5-(4-ヒドロキシ-3,5-ジメトキシ-フェニル)-2-イミノ-thiazol-3-イル]-アセチル}-2-メトキシ-フェノキシ)-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH+)

実施例 1608

- 15 6-{2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 2 (MH+)

実施例 1609

- 20 {2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565. 1 (MH+)

実施例 1610

- 25 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}

シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 607. 4 (MH+)

実施例 1611

5 (3-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ピロリジン-1-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 4 (MH+)

実施例 1612

10 {1-アセチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH+)

実施例 1613

15 2-{2-[3-第3ブチル-4-(3-シアノ-プロポキシ)-5-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 602. 3 (MH+)

実施例 1614

20 {2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 2 (MH+)

実施例 1615

25 (3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ピロリジン-1-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH+)

実施例 1616

5 {1-アセチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 3 (MH+)

実施例 1617

10 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 607. 5 (MH+)

実施例 1618

15 {2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 4 (MH+)

実施例 1619

20 (3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ピロリジン-1-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 4 (MH+)

実施例 1620

25 {1-アセチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 461. 3 (MH+)

実施例 1621

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-
フェノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 542. 4 (MH⁺)

実施例 1622

{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメ
トキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭
化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 542. 2 (MH⁺)

実施例 1623

5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジ
メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン
タン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 584. 4 (MH⁺)

実施例 1624

(3-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ピロリジン-1-
イル)-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH⁺)

実施例 1625

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェ
ノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 579. 4 (MH⁺)

実施例 1626

4-[2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチル)-フェノキシ]-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 516.4 (MH⁺)

5 実施例 1627

{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566.3 (MH⁺)

10 実施例 1628

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608.4 (MH⁺)

15 実施例 1629

4-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 580.4 (MH⁺)

20 実施例 1630

5-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 594.5 (MH⁺)

25 実施例 1631

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ

[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メタンスルフォニルアミノ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 3 (MH+)

実施例 1632

- 5 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 519. 3 (MH+)

実施例 1633

- 10 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 391. 3 (MH+)

実施例 1634

- 15 5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノプロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547. 3 (MH+)

実施例 1635

- 20 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-(3-カルバモイル-プロポキシ)-5-メタンスルフォニルアミノ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 602. 4 (MH+)

実施例 1636

- 25 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-インドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 579. 4 (MH+)

実施例 1637

4-({2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-ブタン酸;

5 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523. 4 (MH+)

実施例 1638

4-({2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-メチル-アミノ)-

10 ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522. 4 (MH+)

実施例 1639

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メタンスルフォニルアミノ-フェノキシ}-ブ

15 チルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 579. 4 (MH+)

実施例 1640

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-ベンジル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢

20 酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556. 4 (MH+)

実施例 1641

1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジ
メトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 428. 4 (MH+)

実施例 1642

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェ
ノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 549. 4 (MH⁺)

5 実施例 1643

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェ
ノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 563. 4 (MH⁺)

10 実施例 1644

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェ
ノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 563. 4 (MH⁺)

15 実施例 1645

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-
フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 609. 5 (MH⁺)

20 実施例 1646

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-
フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 623. 5 (MH⁺)

25 実施例 1647

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ

ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-
フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 623. 5 (MH+)

実施例 1648

- 5 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-
フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 637. 6 (MH+)

実施例 1649

- 10 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586. 5 (MH+)

実施例 1650

- 15 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 600. 5 (MH+)

実施例 1651

- 20 4-{2-第 3 ブチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミ
ノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 600. 5 (MH+)

実施例 1652

- 25 5-{2-第 3 ブチル-6-(3-エトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミ
ノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ

シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 614. 5 (MH+)

実施例 1653

5 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-(2, 5-ジオキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ
-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチル
アミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 3 (MH+)

実施例 1654

10 1-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-2, 5-ジオン;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 482. 3 (MH+)

実施例 1655

15 6-{2-[3-第 3 ブチル-4-(2, 5-ジオキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ
-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カ
ルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506. 3 (MH+)

実施例 1656

20 1-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-2, 5-ジオン;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 445. 3 (MH+)

実施例 1657

25 4-{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカル
バモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタ
ン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 581.5 (MH⁺)

実施例 1658

4-{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 558.4 (MH⁺)

実施例 1659

4-{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 582.5 (MH⁺)

実施例 1660

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 521.5 (MH⁺)

実施例 1661

4-{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 495.4 (MH⁺)

実施例 1662

5-{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 595.5 (MH⁺)

実施例 1663

5-{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572.5 (MH⁺)

5 実施例 1664

5-{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 596.5 (MH⁺)

10 実施例 1665

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535.5 (MH⁺)

15 実施例 1666

5-{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509.4 (MH⁺)

20 実施例 1667

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 515.4 (MH⁺)

25 実施例 1668

N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルホンアミ
ド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 492. 3 (MH⁺)

実施例 1669

- 5 N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルホンア
ミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 455. 3 (MH⁺)

実施例 1670

- 10 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(1-イミノ-5-メトキシ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-
イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 4 (MH⁺)

実施例 1671

- 15 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル
オキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 4 (MH⁺)

実施例 1672

- 20 4-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-
イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-
ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 2 (MH⁺)

実施例 1673

- 25 5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-
イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-

ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 2 (MH+)

実施例 1674

5 4-{2-第3 ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ
-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェ
ノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 604. 3 (MH+)

実施例 1675

10 5-{2-第3 ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ
-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェ
ノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 618. 3 (MH+)

実施例 1676

15 4-{2-第3 ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ
-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 581. 2 (MH+)

実施例 1677

20 5-{2-第3 ブチル-6-(3-シアノ-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ
-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 2 (MH+)

実施例 1678

25 5-{2-第3 ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロ
ピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェ
ノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 576. 3 (MH+)

実施例 1679

- 5 4-{2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 622. 3 (MH+)

実施例 1680

- 10 5-{2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 636. 3 (MH+)

実施例 1681

- 15 4-{2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 599. 2 (MH+)

実施例 1682

- 20 5-{2-第3ブチル-6-(3-カルバモイル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 613. 3 (MH+)

実施例 1683

- 25 4-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514. 2 (MH+)

実施例 1684

5-{4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 477. 2 (MH⁺)

5 実施例 1685

6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ヘキサン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547. 3 (MH⁺)

10 実施例 1686

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 3 (MH⁺)

15 実施例 1687

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 3 (MH⁺)

20 実施例 1688

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH⁺)

25 実施例 1689

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ

[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535. 4 (MH+)

実施例 1690

- 5 6-{2-[3-第 3 ブチル-4, 5-ビス-(3-シアノ-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボ
ン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 575. 3 (MH+)

実施例 1691

- 10 5-{4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 538. 3 (MH+)

実施例 1692

- 15 6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノ
キシ}-ヘキサン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608. 4 (MH+)

実施例 1693

- 20 4-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカル
バモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 554. 3 (MH+)

実施例 1694

- 25 5-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカル
バモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキ

シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 568. 4 (MH+)

実施例 1695

5 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-
フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 582. 4 (MH+)

実施例 1696

10 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-
フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 596. 4 (MH+)

実施例 1697

15 4-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピ
ロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 467. 3 (MH+)

実施例 1698

20 5-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピ
ロロ [3,4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸
塩

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH+)

実施例 1699

25 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b] ピリジ
ン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 3 (MH+)

実施例 1700

5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 509.4 (MH⁺)

実施例 1701

4-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチロニチリル; 臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 551.3 (MH⁺)

実施例 1702

5-{4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸; 臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 514.3 (MH⁺)

実施例 1703

6-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ヘキサン酸; 臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 584.3 (MH⁺)

実施例 1704

4-{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸; 臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 530.3 (MH⁺)

実施例 1705

5-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 3 (MH⁺)

5 実施例 1706

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-プ
タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

10 実施例 1707

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノキシ]-ペ
ンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

15 実施例 1708

4-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブチ
ロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 579. 3 (MH⁺)

20 実施例 1709

5-{4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸
塩

MS:m/e (ESI) 542. 3 (MH⁺)

25 実施例 1710

2-{2-[3-第 3 ブチル-4,5-ビス-(3-シアノ-プロポキシ)-フェニル]-2-オキソ-エ

チル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルア
ミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 574.4 (MH⁺)

実施例 1711

- 5 5-{4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソイン
ドール-2-イル)-アセチル]-2-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537.3 (MH⁺)

実施例 1712

- 10 6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ヘ
キサン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 607.4 (MH⁺)

実施例 1713

- 15 4-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカル
バモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタ
ン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553.4 (MH⁺)

実施例 1714

- 20 5-{2-第 3 ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカル
バモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン
タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567.4 (MH⁺)

実施例 1715

- 25 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノ

キシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 581. 4 (MH+)

実施例 1716

5 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(メチル-プロピル-アミノ)-フェノ
キシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 4 (MH+)

実施例 1717

10 1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミ
ノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 410. 3 (MH+)

実施例 1718

15 {2-第 3 ブチル-4-[2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH+)

実施例 1719

20 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523. 4 (MH+)

実施例 1720

25 {2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミノ
-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 3 (MH+)

実施例 1721

5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-ヒドロキシメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 537. 3 (MH+)

実施例 1722

1-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2-フルオロメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 412. 3 (MH+)

10 実施例 1723

{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-フルオロメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 483. 3 (MH+)

15 実施例 1724

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-フルオロメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 525. 4 (MH+)

20 実施例 1725

{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-フルオロメチル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 497. 3 (MH+)

25 実施例 1726

5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-フルオロメチル-7-イミノ

-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539. 3 (MH⁺)

実施例 1727

- 5 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ペント-4-エニルオキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608. 4 (MH⁺)

実施例 1728

- 10 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ペント-4-エニルオキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 585. 4 (MH⁺)

実施例 1729

- 15 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ペント-4-エニルオキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 548. 4 (MH⁺)

実施例 1730

- 20 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ペント-4-エニルオキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 609. 4 (MH⁺)

実施例 1731

- 25 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェ

ノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 2 (MH⁺)

実施例 1732

5 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェ
ノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551. 3 (MH⁺)

実施例 1733

10 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-
フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 597. 3 (MH⁺)

実施例 1734

15 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-
フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 611. 3 (MH⁺)

実施例 1735

20 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 574. 3 (MH⁺)

実施例 1736

25 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-フルオロ-ピロリジン-1-イル)-フェノキ
シ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 588. 3 (MH⁺)

実施例 1737

- 5 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 635. 2 (MH⁺)

実施例 1738

- 10 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 612. 4 (MH⁺)

実施例 1739

- 15 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 640. 2 (MH⁺)

実施例 1740

- 20 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 575. 2 (MH⁺)

実施例 1741

- 25 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 736. 3 (MH⁺) (Boc 体)

実施例 1742

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 653. 2 (MH⁺)

実施例 1743

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 637. 3 (MH⁺)

実施例 1744

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 614. 2 (MH⁺)

実施例 1745

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 642. 3 (MH⁺)

実施例 1746

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 577. 2 (MH⁺)

実施例 1747

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 738. 2 (MH⁺) (Boc 体)

5 実施例 1748

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-4-フルオロ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 655. 1 (MH⁺)

10 実施例 1749

4-{2-第 3 ブチル-6-(3-カルボキシ-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 612. 1 (MH⁺)

15 実施例 1750

4-{2-第 3 ブチル-6-(3-カルボキシ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 589. 0 (MH⁺)

20 実施例 1751

4-{2-第 3 ブチル-6-(3-カルボキシ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 617. 0 (MH⁺)

25 実施例 1752

4-{2-第 3 ブチル-6-(3-カルボキシ-プロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イ

ミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブ
タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 552.0 (MH⁺)

実施例 1753

- 5 4-{2-第3ブチル-6-(3-カルボキシ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-
メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-
フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 613.0 (MH⁺)

実施例 1754

- 10 5-{2-第3ブチル-6-(4-カルボキシ-ブトキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メ
チルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 640.0 (MH⁺)

実施例 1755

- 15 5-{2-第3ブチル-6-(4-カルボキシ-ブトキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-
ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペ
ンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 617.0 (MH⁺)

実施例 1756

- 20 5-{2-第3ブチル-6-(4-カルボキシ-ブトキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオ
ロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペ
ンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 645.0 (MH⁺)

実施例 1757

- 25 5-{2-第3ブチル-6-(4-カルボキシ-ブトキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミ
ノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン

タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 580. 0 (MH+)

実施例 1758

5 5-{2-第 3 ブチル-6-(4-カルボキシ-プトキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メ
チルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フ
エノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 641. 0 (MH+)

実施例 1759

10 4-{2-第 3 ブチル-6-(エチル-メチル-アミノ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-
ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブ
タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 2 (MH+)

実施例 1760

15 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フェノキ
シ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 3 (MH+)

実施例 1761

20 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フェノキシ]-
ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 3 (MH+)

実施例 1762

25 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒ
ドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フ
エノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 568. 3 (MH⁺)

実施例 1763

4-{2-第 3 ブチル-6-(エチル-メチル-アミノ)-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5, 7-ジ
ヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化
5 水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH⁺)

実施例 1764

5-{2-第 3 ブチル-6-(エチル-メチル-アミノ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-
ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペ
10 ンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH⁺)

実施例 1765

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フェノキ
15 シ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 581. 3 (MH⁺)

実施例 1766

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フェノキシ]-
20 ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH⁺)

実施例 1767

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(エチル-メチル-アミノ)-フ
25 エノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 582. 3 (MH⁺)

実施例 1768

5-{2-第 3 ブチル-6-(エチル-メチル-アミノ)-4-[2-(7-イミノ-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 495. 3 (MH+)

実施例 1769

{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジエチルアミノ-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 493. 3 (MH+)

実施例 1770

{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 554. 3 (MH+)

実施例 1771

{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 530. 3 (MH+)

実施例 1772

{2-第 3 ブチル-6-ジエチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 553. 4 (MH+)

実施例 1773

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586.5 (MH⁺)

5 実施例 1774

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 647.5 (MH⁺)

10 実施例 1775

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 623.5 (MH⁺)

15 実施例 1776

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 651.5 (MH⁺)

20 実施例 1777

4-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 646.5 (MH⁺)

25 実施例 1778

4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ

-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 533. 4 (MH⁺)

実施例 1779

- 5 4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 594. 5 (MH⁺)

実施例 1780

- 10 4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 4 (MH⁺)

実施例 1781

- 15 4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 598. 5 (MH⁺)

実施例 1782

- 20 4-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 593. 5 (MH⁺)

実施例 1783

- 25 5-{3-第3ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタ

ン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547. 4 (MH+)

実施例 1784

- 5 5-{3-第 3 ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608. 5 (MH+)

実施例 1785

- 10 5-{3-第 3 ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 584. 5 (MH+)

実施例 1786

- 15 5-{3-第 3 ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 612. 5 (MH+)

実施例 1787

- 20 5-{3-第 3 ブチル-2-(3-シアノ-プロポキシ)-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 607. 2 (MH+)

実施例 1788

- 25 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 2 (MH+)

実施例 1789

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニルアミノ}-ブタン酸;臭化水素

5 酸塩

MS:m/e (ESI) 509. 2 (MH+)

実施例 1790

5-{2-第 3 ブチル-6-(2-シアノ-エチル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-
ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;

10 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 517. 2 (MH+)

実施例 1791

5-{2-第 3 ブチル-6-(2-シアノ-エチル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメト
キシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン

15 酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 554. 2 (MH+)

実施例 1792

5-{2-第 3 ブチル-6-(2-シアノ-エチル)-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イ
ミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン

20 酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 582. 3 (MH+)

実施例 1793

5-{2-第 3 ブチル-6-(2-シアノ-エチル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカ
ルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペ

25 ンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 577. 3 (MH+)

実施例 1794

4-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 628. 2 (MH⁺)

実施例 1795

1-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 469. 3 (MH⁺)

10 実施例 1796

5-{2-第3ブチル-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 582. 4 (MH⁺)

15 実施例 1797

{2-第3ブチル-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 3 (MH⁺)

20 実施例 1798

4-{3-第3ブチル-5-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-2-ヒドロキシ-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 2 (MH⁺)

25 実施例 1799

4-{2-第3ブチル-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]

ピラジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェノキシ}-ブチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 3 (MH+)

実施例 1800

- 5 {2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 554. 3 (MH+)

実施例 1801

- 10 5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2,3-ジエトキシ-5-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピラジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 596. 3 (MH+)

実施例 1802

- 15 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 3 (MH+)

実施例 1803

- 20 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 560. 3 (MH+)

実施例 1804

- 25 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-イ

ソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 3 (MH+)

実施例 1805

5 5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチ
ル}-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 597. 3 (MH+)

実施例 1806

10 5-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチ
ル}-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 618. 3 (MH+)

実施例 1807

15 5-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチ
ル}-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-カルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 620. 3 (MH+)

実施例 1808

20 5-{2-(2-シアノ-1,1-ジメチル-エチル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカ
ルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペ
ンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 549. 4 (MH+)

実施例 1809

25 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチル
カルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-
ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 591. 4 (MH+)

実施例 1810

- 5 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 635. 5 (MH+)

実施例 1811

- 10 {2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 593. 4 (MH+)

実施例 1812

- 15 6-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 545. 3 (MH+)

実施例 1813

- 20 2-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-シクロプロパンカルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 591. 4 (MH+)

実施例 1814

- 25 5-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 609. 5 (MH+)

実施例 1815

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメ
トキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 568.4 (MH⁺)

実施例 1816

5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジ
メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキ
シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 612.4 (MH⁺)

実施例 1817

{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメ
トキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-
酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 570.3 (MH⁺)

実施例 1818

6-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522.3 (MH⁺)

20 実施例 1819

2-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-シ
クロプロパンカルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 568.4 (MH⁺)

25 実施例 1820

5-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ

-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 609.4 (MH⁺)

実施例 1821

- 5 (2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-エトキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572.3 (MH⁺)

実施例 1822

- 10 5-{2-(2-シアノ-1,1-ジメチル-エチル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 489.3 (MH⁺)

実施例 1823

- 15 5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 531.4 (MH⁺)

実施例 1824

- 20 5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 575.4 (MH⁺)

実施例 1825

- 25 {2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}

シ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 533. 3 (MH+)

実施例 1826

- 5 6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 485. 2 (MH+)

実施例 1827

- 10 2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシメチル}-
シクロプロパンカルボン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 531. 1 (MH+)

実施例 1828

- 15 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ}-ペン
タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 549. 5 (MH+)

実施例 1829

- 20 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン
酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 532. 9 (MH+)

実施例 1830

- 25 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノ
キシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 546. 9 (MH+)

実施例 1831

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フ
ェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 548. 9 (MH⁺)

実施例 1832

4-{2-第 3 ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-
イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-
ブタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 557. 9 (MH⁺)

実施例 1833

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェノ
キシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 560. 9 (MH⁺)

実施例 1834

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フ
ェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 562. 9 (MH⁺)

実施例 1835

5-{2-第 3 ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-
イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-
ペンタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 571. 9 (MH⁺)

実施例 1836

(2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-エトキ
シ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 534. 8 (MH⁺)

5 実施例 1837

5-{2-(2-シアノ-1,1-ジメチル-エチル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカ
ルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキ
シ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 549. 8 (MH⁺)

10 実施例 1838

5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチル
カルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノ
キシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 591. 9 (MH⁺)

15 実施例 1839

5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチ
ルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチ
ル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 635. 9 (MH⁺)

20 実施例 1840

{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチル
カルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチ
ル]-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 593. 8 (MH⁺)

25 実施例 1841

6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ

ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ニコチン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 545. 8 (MH+)

実施例 1842

- 5 (2-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-エトキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 9 (MH+)

実施例 1843

- 10 5-{2-(2-シアノ-1,1-ジメチル-エチル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553. 8 (MH+)

実施例 1844

- 15 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロピル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 9 (MH+)

実施例 1845

- 20 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[4-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 640. 9 (MH+)

実施例 1846

- 25 (6-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;

臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 559. 1 (MH+)

実施例 1847

5 5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535. 2 (MH+)

実施例 1848

10 3-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 637. 3 (MH+)

実施例 1849

15 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 665. 3 (MH+)

実施例 1850

20 (6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 536. 2 (MH+)

実施例 1851

25 5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 512. 2 (MH+)

実施例 1852

- 5 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 642. 3 (MH+)

実施例 1853

- 10 (6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 564. 2 (MH+)

実施例 1854

- 15 5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 2 (MH+)

実施例 1855

- 20 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 670. 2 (MH+)

実施例 1856

- 25 (6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 499. 1 (MH+)

実施例 1857

5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 475. 2 (MH+)

実施例 1858

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 591. 2 (MH+)

実施例 1859

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 605. 2 (MH+)

実施例 1860

(6-{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ピリジン-3-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 560. 1 (MH+)

実施例 1861

5-{2-(シアノ-ジメチル-メチル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 536. 2 (MH+)

実施例 1862

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 652. 2 (MH⁺)

5 実施例 1863

5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チアゾール-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 666. 2 (MH⁺)

10 実施例 1864

4-{5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506. 3 (MH⁺)

15 実施例 1865

4-{5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 483. 3 (MH⁺)

20 実施例 1866

4-{5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-インドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 3 (MH⁺)

25 実施例 1867

4-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-

イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロインドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 447. 3 (MH+)

実施例 1868

- 5 4-{5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロインドール-1-イル}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 508. 3 (MH+)

実施例 1869

- 10 {3-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 3 (MH+)

実施例 1870

- 15 4-{3-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523. 3 (MH+)

実施例 1871

- 20 5-{3-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 3 (MH+)

実施例 1872

- 25 {3-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 472. 2 (MH+)

実施例 1873

4-{3-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 500. 2 (MH⁺)

5 実施例 1874

5-{3-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH⁺)

10 実施例 1875

{3-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 435. 2 (MH⁺)

実施例 1876

15 4-{3-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 463. 3 (MH⁺)

実施例 1877

20 5-{3-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 477. 3 (MH⁺)

実施例 1878

25 {3-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 2 (MH⁺)

実施例 1879

4-{3-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン
酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 524. 3 (MH+)

実施例 1880

5-{3-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 538. 3 (MH+)

実施例 1881

{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 500. 2 (MH+)

15 実施例 1882

4-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 2 (MH+)

実施例 1883

20 5-{3-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-アセチル]-5-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸
塩

MS:m/e (ESI) 542. 3 (MH+)

実施例 1884

25 2-{2-[3-第3ブチル-4-(メタンスルフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキ
ソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチ

ルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 515. 5 (MH⁺)

実施例 1885

5 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキ
シ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 664. 3 (MH⁺)

実施例 1886

10 [2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェ
ノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565. 2 (MH⁺)

実施例 1887

15 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フ
エノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 607. 3 (MH⁺)

実施例 1888

20 {2-第 3 ブチル-4-[4-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキ
シ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 579. 3 (MH⁺)

実施例 1889

25 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-ブ
タン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 593. 3 (MH+)

実施例 1890

5-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 632. 3 (MH+)

実施例 1891

10 N-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 492. 2 (MH+)

実施例 1892

15 5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフエン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 641. 2 (MH+)

実施例 1893

20 [2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 2 (MH+)

実施例 1894

25 5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 584. 3 (MH+)

実施例 1895

5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-モルフォリン-4-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 586. 3 (MH+)

実施例 1896

N-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルホンアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 520. 2 (MH+)

実施例 1897

5-[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 669. 3 (MH+)

実施例 1898

[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 570. 3 (MH+)

実施例 1899

5-[2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 612. 3 (MH+)

実施例 1900

{2-第3ブチル-4-[4-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 584. 3 (MH⁺)

5 実施例 1901

5-{2-第3ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 637. 2 (MH⁺)

10 実施例 1902

5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロボキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 604. 2 (MH⁺)

15 実施例 1903

[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 2 (MH⁺)

20 実施例 1904

{2-第3ブチル-4-[4-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 519. 2 (MH⁺)

25 実施例 1905

6-{2-[3-第3ブチル-4-(メタンсульフォニル-メチル-アミノ)-フェニル]-2-オキ

ソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-
カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 516. 1 (MH⁺)

実施例 1906

- 5 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロ
ポキシ)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 665. 2 (MH⁺)

実施例 1907

- 10 {2-第 3 ブチル-4-[4-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢
酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556. 2 (MH⁺)

実施例 1908

- 15 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピペリジン-1-イル-フェノキシ}-ブタン酸;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 3 (MH⁺)

実施例 1909

- 20 N-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-メタンスルホンア
ミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 455. 2 (MH⁺)

実施例 1910

- 25 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノ

キシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547. 3 (MH⁺)

実施例 1911

5 [2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 2 (MH⁺)

実施例 1912

10 5-[2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(2-メチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608. 2 (MH⁺)

実施例 1913

15 {2-第 3 ブチル-4-[4-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-3-オキソ-ブチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 580. 2 (MH⁺)

実施例 1914

20 5-{2-第 3 ブチル-6-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ [3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 633. 2 (MH⁺)

実施例 1915

25 2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 ブチル-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 479. 4 (MH+)

実施例 1916

{2-第 3 ブチル-4-[3-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 565. 4 (MH+)

実施例 1917

{2-第 3 ブチル-4-[3-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 570. 4 (MH+)

実施例 1918

N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 456. 3 (MH+)

実施例 1919

{2-第 3 ブチル-4-[3-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 542. 1 (MH+)

実施例 1920

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-2-フルオロ-ペンタン酸;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 588. 2 (MH+)

実施例 1921

{2-第 3 ブチル-4-[3-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 505. 2 (MH+)

実施例 1922

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-2-フルオロ-ペンタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 551. 3 (MH+)

実施例 1923

6-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 ブチル-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 480. 3 (MH+)

実施例 1924

{2-第 3 ブチル-4-[3-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-2-オキソ-プロピル]-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 566. 3 (MH+)

実施例 1925

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 650. 2 (MH+)

実施例 1926

4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-[(3-フルオロ-プロピル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 599. 2 (MH⁺)

5 実施例 1927

5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 611. 3 (MH⁺)

10 実施例 1928

{8-第 3 ブチル-4-シクロプロピル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 563. 2 (MH⁺)

15 実施例 1929

5-{4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 2 (MH⁺)

20 実施例 1930

2-[2-(8-第 3 ブチル-4-メタンсульフォニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 543. 2 (MH⁺)

25 実施例 1931

4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 627. 2 (MH⁺)

実施例 1932

- 5 4-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-[(3-フルオロ-プロピル)-メチル-アミノ]}-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 576. 3 (MH⁺)

実施例 1933

- 10 5-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]}-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 588. 3 (MH⁺)

実施例 1934

- 15 {8-第3ブチル-4-シクロプロピル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 2 (MH⁺)

実施例 1935

- 20 5-{4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 503. 2 (MH⁺)

実施例 1936

- 25 1-(8-第3ブチル-4-メタンсульフォニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 520. 2 (MH+)

実施例 1937

5 4-[2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チオフェン-2-イル-プロポキシ)-フ
ェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 590. 3 (MH+)

実施例 1938

10 4-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-[(3-フルオロ-プロピル)-メチル-アミ
ノ]-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539. 3 (MH+)

実施例 1939

15 5-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-
フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551. 3 (MH+)

実施例 1940

20 {8-第 3 ブチル-4-シクロプロピル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]
オキサジン-3-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 503. 3 (MH+)

実施例 1941

25 5-{4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-
イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 466. 2 (MH+)

実施例 1942

1-(8-第3ブチル-4-メタンスルフォニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジ
ン-6-イル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ
ン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 483. 2 (MH⁺)

5 実施例 1943

4-[2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-チオフエン-2-イル-プロ
ポキシ)-フェノキシ]-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 651. 3 (MH⁺)

10 実施例 1944

4-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-[(3-フルオロ-プロピル)-メ
チル-アミノ]}-フェノキシ}-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 600. 3 (MH⁺)

15 実施例 1945

5-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-[(2-メトキシ-エチル)-メチ
ル-アミノ]}-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 612. 3 (MH⁺)

20 実施例 1946

{8-第3ブチル-4-シクロプロピル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバ
モイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3,4-ジヒドロ
-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 564. 2 (MH⁺)

25 実施例 1947

5-{4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ

[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-フェノキシ}-ペンタン
酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 527. 2 (MH⁺)

実施例 1948

- 5 6-[2-(8-第 3 ブチル-4-メタンスルフォニル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 1 (MH⁺)

実施例 1949

- 10 {8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565. 4 (MH⁺)

実施例 1950

- 15 {8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 3 (MH⁺)

実施例 1951

- 20 {8-第 3 ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 4 (MH⁺)

実施例 1952

- 25 5-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノメチル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イル}-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

ル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 632. 3 (MH⁺)

実施例 1953

5 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノメチル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 609. 3 (MH⁺)

実施例 1954

10 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノメチル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 4 (MH⁺)

実施例 1955

15 5-{2-第3ブチル-6-(3-シアノメチル-ピロリジン-1-イル)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 633. 5 (MH⁺)

実施例 1956

20 5-{4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 0 (MH⁺)

実施例 1957

25 5-{4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 0 (MH+)

実施例 1958

5 5-{4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535. 1 (MH+)

実施例 1959

10 5-{4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-イソプロポキシ-6-ピロリジン-1-イル-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 596. 2 (MH+)

実施例 1960

15 {8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 3 (MH+)

実施例 1961

20 メチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486. 2 (MH+)

実施例 1962

25 メチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 458. 2 (MH+)

実施例 1963

メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 421. 3 (MH+)

実施例 1964

メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 481. 3 (MH+)

実施例 1965

メチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 482. 3 (MH+)

実施例 1966

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 526. 4 (MH+)

実施例 1967

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 498. 4 (MH+)

実施例 1968

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 461.4 (MH⁺)

5 実施例 1969

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521.4 (MH⁺)

10 実施例 1970

ピロリジン-1-カルボン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522.4 (MH⁺)

15 実施例 1971

(1-{2-ブトキシ-3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 623.5 (MH⁺)

20 実施例 1972

(1-{2-ブトキシ-3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 600.4 (MH⁺)

25 実施例 1973

(1-{2-ブトキシ-3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ

-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 563. 4 (MH⁺)

実施例 1974

- 5 (1-{2-ブトキシ-3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピロリジン-3-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 624. 5 (MH⁺)

実施例 1975

- 10 5-[2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 637. 5 (MH⁺)

実施例 1976

- 15 5-[2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 614. 4 (MH⁺)

実施例 1977

- 20 5-[2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 577. 4 (MH⁺)

実施例 1978

- 25 5-[2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリ

ジン-1-イル)-フェノキシ]-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 638. 5 (MH⁺)

実施例 1979

5 [2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 4 (MH⁺)

実施例 1980

10 [2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 3 (MH⁺)

実施例 1981

15 [2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535. 3 (MH⁺)

実施例 1982

20 [2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-(3-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル)-フェノキシ]-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 596. 4 (MH⁺)

実施例 1983

25 {8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 3 (MH+)

実施例 1984

- 5 {8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH+)

実施例 1985

- 10 {8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジ
ン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 477. 3 (MH+)

実施例 1986

- 15 {8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒド
ロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベン
ゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 538. 3 (MH+)

実施例 1987

- 20 2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジ
ヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン
-3-イルオキシ)-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 609. 2 (MH+)

実施例 1988

- 25 2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル
オキシ)-ブタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586. 2 (MH+)

実施例 1989

2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-3-イル
オキシ)-ブタン酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 549. 3 (MH+)

実施例 1990

2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジ
ヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロ
リジン-3-イルオキシ)-ブタン酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 610. 5 (MH+)

実施例 1991

2-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ
-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン
タン酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 612. 6 (MH+)

実施例 1992

2-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジ
メトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペン
タン酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 584. 5 (MH+)

実施例 1993

2-{2-第 3 ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ
-5,7-ジヒドロ-ピロロ [3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタ
ン酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 547. 5 (MH+)

実施例 1994

2-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 607.5 (MH⁺)

5 実施例 1995

2-{2-第3ブチル-6-(3-シアノ-プロポキシ)-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-ペンタン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608.5 (MH⁺)

10 実施例 1996

ピロリジン-1,2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル} エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570.4 (MH⁺)

15 実施例 1997

ピロリジン-1,2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル} エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542.4 (MH⁺)

20 実施例 1998

ピロリジン-1,2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル} エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505.4 (MH⁺)

25 実施例 1999

ピロリジン-1,2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-

メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル} エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565.5 (MH⁺)

実施例 2000

- 5 ピロリジン-1,2-ジカルボン酸 1-{2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル} エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566.5 (MH⁺)

実施例 2001

- 10 8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-カルボン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528.4 (MH⁺)

実施例 2002

- 15 8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-カルボン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556.4 (MH⁺)

実施例 2003

- 20 8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-カルボン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 491.5 (MH⁺)

実施例 2004

- 25 (1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-

イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 594. 7 (MH+)

実施例 2005

- 5 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル
オキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 571. 7 (MH+)

実施例 2006

- 10 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリ
ジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 8 (MH+)

実施例 2007

- 15 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イ
ミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 458. 3 (MH+)

実施例 2008

- 20 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピ
ル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素
酸塩

MS:m/e (ESI) 421. 3 (MH+)

実施例 2009

- 25 6-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 482. 4 (MH⁺)

実施例 2010

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン

5 酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 480. 4 (MH⁺)

実施例 2011

8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オ

10 キサジン-2-カルボン酸 エチル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551. 5 (MH⁺)

実施例 2012

{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]

15 オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 3 (MH⁺)

実施例 2013

{8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ

20 ジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 3 (MH⁺)

実施例 2014

{8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ

25 ジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514. 3 (MH⁺)

実施例 2015

{8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 477.3 (MH⁺)

実施例 2016

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 538.3 (MH⁺)

実施例 2017

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 500.8 (MH⁺)

実施例 2018

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 506.8 (MH⁺)

実施例 2019

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 478.8 (MH⁺)

実施例 2020

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 441.9 (MH+)

5 実施例 2021

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 501.9 (MH+)

10 実施例 2022

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502.9 (MH+)

15 実施例 2023

メチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 480.0 (MH+)

20 実施例 2024

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565.0 (MH+)

25 実施例 2025

(1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-

イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 0 (MH⁺)

実施例 2026

- 5 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 0 (MH⁺)

実施例 2027

- 10 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 0 (MH⁺)

実施例 2028

- 15 ジメチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 9 (MH⁺)

実施例 2029

- 20 ジメチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 499. 9 (MH⁺)

実施例 2030

- 25 ジメチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 471. 8 (MH+)

実施例 2031

- 5 ジメチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 434. 9 (MH+)

実施例 2032

- 10 ジメチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 494. 9 (MH+)

実施例 2033

- 15 ジメチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 9 (MH+)

実施例 2034

- 20 2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 480. 9 (MH+)

実施例 2035

- 25 1-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486. 9 (MH+)

実施例 2036

1-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 458.9 (MH⁺)

実施例 2037

1-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 421.9 (MH⁺)

10 実施例 2038

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 481.9 (MH⁺)

15 実施例 2039

6-[2-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 482.9 (MH⁺)

20 実施例 2040

2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 571.0 (MH⁺)

25 実施例 2041

2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ

ソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 577. 0 (MH+)

実施例 2042

- 5 2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 548. 9 (MH+)

実施例 2043

- 10 2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 9 (MH+)

実施例 2044

- 15 2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 572. 0 (MH+)

実施例 2045

- 20 2-{2-第 3 ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-3-フェニル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 573. 0 (MH+)

実施例 2046

- 25 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインド

ール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 504. 3 (MH+)

実施例 2047

5 6-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン
-6-イル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 3 (MH+)

実施例 2048

10 {8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-
アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509. 4 (MH+)

実施例 2049

15 {8-第 3 ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-ア
セトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 444. 3 (MH+)

実施例 2050

20 2-[2-(8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン
-6-イル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソ
インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 503. 4 (MH+)

実施例 2051

25 2-{2-[8-第 3 ブチル-4-(3H-[1,2,3]トリアゾール-4-イルメチル)-3,4-ジヒドロ
-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ
-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 546.0 (MH⁺)

実施例 2052

- 5 6-{2-[8-第 3 ブチル-4-(3H-[1, 2, 3] トリアゾール-4-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547.0 (MH⁺)

実施例 2053

- 10 1-[8-第 3 ブチル-4-(3H-[1, 2, 3] トリアゾール-4-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551.0 (MH⁺)

実施例 2054

- 15 1-[8-第 3 ブチル-4-(3H-[1, 2, 3] トリアゾール-4-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486.0 (MH⁺)

実施例 2055

- 20 2-{2-[8-第 3 ブチル-4-(3H-[1, 2, 3] トリアゾール-4-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 545.0 (MH⁺)

実施例 2056

- 25 {8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-6-メトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]

オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 3 (MH+)

実施例 2057

- 5 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン
-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 536. 8 (MH+)

実施例 2058

- 10 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5, 7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オ
キサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 8 (MH+)

実施例 2059

- 15 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イ
ル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 513. 8 (MH+)

実施例 2060

- 20 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-イ
ル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 541. 9 (MH+)

実施例 2061

- 25 2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]オキサジン-4-
イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 476. 9 (MH+)

実施例 2062

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]

5 オキサジン-4-イル}-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 536. 0 (MH+)

実施例 2063

2-{2-[8-第 3 ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベン
ゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒ

10 ドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 546. 8 (MH+)

実施例 2064

6-{2-[8-第 3 ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベン
ゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒ

15 ドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 548. 3 (MH+)

実施例 2065

1-[8-第 3 ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ
[1,4]オキサジン-6-イル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒド

20 ロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523. 8 (MH+)

実施例 2066

1-[8-第 3 ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ
[1,4]オキサジン-6-イル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒド

25 ロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 552. 3 (MH+)

実施例 2067

1-[8-第 3 ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ
[1,4]オキサジン-6-イル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 487.3 (MH⁺)

実施例 2068

2-{2-[8-第 3 ブチル-4-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベン
ゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ
-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 546.3 (MH⁺)

実施例 2069

{8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモ
イル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ
-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 576.3 (MH⁺)

実施例 2070

{8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-
ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 581.3 (MH⁺)

実施例 2071

{8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-
ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 553.3 (MH⁺)

実施例 2072

{8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 516.3 (MH⁺)

5 実施例 2073

{8-第 3 ブチル-4-シアノメチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 577.3 (MH⁺)

10 実施例 2074

{8-第 3 ブチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 594.3 (MH⁺)

15 実施例 2075

{8-第 3 ブチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 599.3 (MH⁺)

20 実施例 2076

{8-第 3 ブチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 571.2 (MH⁺)

25 実施例 2077

{8-第 3 ブチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-

ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 534. 2 (MH⁺)

実施例 2078

- 5 {8-第 3 ブチル-4-カルバモイルメチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イル}-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 595. 3 (MH⁺)

実施例 2079

- 10 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-5-エトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 9 (MH⁺)

実施例 2080

- 15 {2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 8 (MH⁺)

実施例 2081

- 20 {2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 483. 8 (MH⁺)

実施例 2082

- 25 {2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水

素酸塩MS:m/e (ESI) 446.9 (MH⁺)

実施例 2083

5 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-5-エトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506.9 (MH⁺)

実施例 2084

10 6-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-5-エトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507.9 (MH⁺)

実施例 2085

15 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-シアノメトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 461.9 (MH⁺)

実施例 2086

20 {2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 467.9 (MH⁺)

実施例 2087

25 {2-第 3 ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 439.9 (MH⁺)

実施例 2088

{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 402. 9 (MH+)

実施例 2089

- 5 2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 462. 9 (MH+)

実施例 2090

- 10 6-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 463. 9 (MH+)

実施例 2091

- 15 2-[2-(3-第3ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 2 (MH+)

実施例 2092

- 20 2-[2-(3-第3ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 492. 3 (MH+)

実施例 2093

- 25 {3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498. 3 (MH+)

実施例 2094

- 5 {3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化

水素酸塩

MS:m/e (ESI) 470. 3 (MH+)

実施例 2095

- 10 6-[2-(3-第3ブチル-5-シアノメトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチ
ル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 494. 3 (MH+)

実施例 2096

- 15 {3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 433. 3 (MH+)

実施例 2097

- 20 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ
-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチル
アミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH+)

実施例 2098

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ
-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル
ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 520. 4 (MH+)

実施例 2099

4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭

5 化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 4 (MH+)

実施例 2100

4-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニチリル;臭

10 化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498. 3 (MH+)

実施例 2101

6-{2-[3-第3ブチル-5-(3-シアノ-プロポキシ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カ

15 ルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522. 4 (MH+)

実施例 2102

4-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェノキシ}-ブチロニチリル;

20 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 461. 3 (MH+)

実施例 2103

2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル

25 ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 504. 8 (MH+)

実施例 2104

{2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソ
インドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-アセトニトリ
ル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 510.8 (MH⁺)

実施例 2105

{2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェノキシ}-アセトニトリ
ル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 482.8 (MH⁺)

実施例 2106

{2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェノキシ}-アセトニトリル;
臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 445.9 (MH⁺)

実施例 2107

2-[2-(3-第3ブチル-4-シアノメトキシ-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-オキシ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチル
アミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 505.9 (MH⁺)

実施例 2108

6-[2-(3-第3ブチル-4-カルバモイルメトキシ-5-ジメチルアミノ-フェニル)-2-
オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン
-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 524.9 (MH⁺)

実施例 2109

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551.4 (MH⁺)

5 実施例 2110

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 552.4 (MH⁺)

10 実施例 2111

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528.3 (MH⁺)

15 実施例 2112

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556.4 (MH⁺)

20 実施例 2113

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 491.4 (MH⁺)

25 実施例 2114

2-{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル

-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]
オキサジン-4-イル)-2-メチル-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 550. 4 (MH⁺)

実施例 2115

- 5 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-オキソ-
エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチル
アミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523. 4 (MH⁺)

実施例 2116

- 10 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエチ
キシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 4 (MH⁺)

実施例 2117

- 15 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ
-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 500. 3 (MH⁺)

実施例 2118

- 20 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(2-シクロプ
ロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 463. 4 (MH⁺)

実施例 2119

- 25 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エ
チル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボ

ン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506.0 (MH⁺)

実施例 2120

5 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエチキ
シ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 512.0 (MH⁺)

実施例 2121

10 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ
-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 483.9 (MH⁺)

実施例 2122

15 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-(2-シクロプロ
ピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水
素酸塩

MS:m/e (ESI) 447.0 (MH⁺)

実施例 2123

20 2-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エ
チル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルア
ミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507.0 (MH⁺)

実施例 2124

25 6-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピロリジン-1-イル-フェニル)-2-オキソ-エ
チル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボ
ン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 508. 0 (MH+)

実施例 2125

2-[2-(4-シアノメトキシ-3-イソプロピル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エト
キシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素

5 酸塩

MS:m/e (ESI) 449. 3 (MH+)

実施例 2126

2-[2-(4-シアノメトキシ-3-イソプロピル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメ
チルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルア

10 ミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 448. 3 (MH+)

実施例 2127

{4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-アセチル]-2-イソプロピル-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 454. 3 (MH+)

実施例 2128

{4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-アセチル]-2-イソプロピル-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 426. 3 (MH+)

20 実施例 2129

{4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
ル)-アセチル]-2-イソプロピル-フェノキシ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 389. 3 (MH+)

実施例 2130

25 6-[2-(4-カルバモイルメトキシ-3-イソプロピル-フェニル)-2-オキシ-エチ
ル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン

酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 4 (MH+)

実施例 2131

5 2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 467. 3 (MH+)

実施例 2132

10 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-エタノン;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 472. 4 (MH+)

実施例 2133

15 1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-
イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 444. 3 (MH+)

実施例 2134

20 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
ル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-エタノン;臭
化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 407. 3 (MH+)

実施例 2135

25 6-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468. 4 (MH+)

実施例 2136

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル
5 オキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 599. 7 (MH+)

実施例 2137

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル
10 オキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 534. 8 (MH+)

実施例 2138

(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペ
15 リジン-4-イルオキシ)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 593. 9 (MH+)

実施例 2139

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミ
20 ド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 9 (MH+)

実施例 2140

1-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ
-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水
25 素酸塩

MS:m/e (ESI) 500. 9 (MH+)

実施例 2141

1-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 472.9 (MH⁺)

実施例 2142

1-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 436.0 (MH⁺)

実施例 2143

6-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 497.0 (MH⁺)

実施例 2144

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-イソプロポキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 495.0 (MH⁺)

実施例 2145

2-[2-(3-第 3 ブチル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 408.3 (MH⁺)

25 実施例 2146

1-(3-第 3 ブチル-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒ

ドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 385. 3 (MH+)

実施例 2147

6-[2-(3-第 3 ブチル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジ

5 ヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 409. 3 (MH+)

実施例 2148

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(7-イミノ
-2-メチル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸

10 塩

MS:m/e (ESI) 437. 4 (MH+)

実施例 2149

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-(2-エチル
-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸

15 塩

MS:m/e (ESI) 451. 4 (MH+)

実施例 2150

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-オキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

20 -5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 535. 3 (MH+)

実施例 2151

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-オン;臭

25 化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 3 (MH+)

実施例 2152

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-オン; 臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 512. 3 (MH⁺)

実施例 2153

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-オン; 臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 475. 4 (MH⁺)

実施例 2154

6-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-オキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 536. 4 (MH⁺)

実施例 2155

2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 535. 3 (MH⁺)

実施例 2156

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-2-オン; 臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 540. 3 (MH⁺)

実施例 2157

1-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 512.4 (MH⁺)

5 実施例 2158

1-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 475.4 (MH⁺)

10 実施例 2159

6-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 536.4 (MH⁺)

15 実施例 2160

2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 609.1 (MH⁺)

20 実施例 2161

2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イルオキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 614.1 (MH⁺)

25 実施例 2162

2-(1-{3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル

-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペ
リジン-4-イルオキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 608. 1 (MH⁺)

実施例 2163

- 5 2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジ
ヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペ
リジン-4-イルオキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 610. 1 (MH⁺)

実施例 2164

- 10 2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル
オキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 586. 1 (MH⁺)

実施例 2165

- 15 2-(1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル
オキシ)-プロピオン酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 549. 1 (MH⁺)

実施例 2166

- 20 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551. 0 (MH⁺)

実施例 2167

- 25 1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-

イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556. 0 (MH+)

実施例 2168

5 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 550. 1 (MH+)

実施例 2169

10 6-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 552. 1 (MH+)

実施例 2170

15 1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528. 0 (MH+)

実施例 2171

20 1-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(4-メトキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
ル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 491. 0 (MH+)

実施例 2172

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキシ-ピロリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH+)

実施例 2173

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-オン; 臭

5 化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 3 (MH+)

実施例 2174

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-オン; 臭

10 化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498. 3 (MH+)

実施例 2175

1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b] ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピロリジン-2-オ

15 ン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 461. 3 (MH+)

実施例 2176

6-{2-[3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピ

20 リジン-2-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522. 4 (MH+)

実施例 2177

{8-第 3 ブチル-6-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1, 3-ジヒド
ロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]

25 オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 567. 3 (MH+)

実施例 2178

{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 572.3 (MH⁺)

実施例 2179

{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 544.3 (MH⁺)

実施例 2180

{8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 507.3 (MH⁺)

実施例 2181

{8-第3ブチル-6-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-2-イルメトキシ}-酢酸;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 568.4 (MH⁺)

実施例 2182

2-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 523.3 (MH⁺)

実施例 2183

3-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-オキサゾリジン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 528.3 (MH⁺)

5 実施例 2184

3-{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-オキサゾリジン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 500.3 (MH⁺)

10 実施例 2185

3-{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-オキサゾリジン-2-オン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 463.3 (MH⁺)

15 実施例 2186

6-{2-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524.3 (MH⁺)

20 実施例 2187

1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-カルボニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551.0 (MH⁺)

25 実施例 2188

2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-カルボニトリル;臭化水素酸塩

ル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 545.1 (MH⁺)

実施例 2189

- 5 6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-シアノ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547.0 (MH⁺)

実施例 2190

- 10 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-カルボ
ニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523.0 (MH⁺)

実施例 2191

- 15 1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-カル
ボニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486.0 (MH⁺)

実施例 2192

- 20 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒ
ドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-
イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 578.7 (MH⁺)

実施例 2193

- 25 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イ

ル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 583. 8 (MH+)

実施例 2194

5 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペ
リジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 577. 9 (MH+)

実施例 2195

10 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリ
ジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 580. 0 (MH+)

実施例 2196

15 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-
イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イ
ル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 556. 0 (MH+)

実施例 2197

20 (1-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イ
ル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 519. 0 (MH+)

実施例 2198

25 2-[2-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-
エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化
水素酸塩

MS:m/e (ESI) 459. 2 (MH+)

実施例 2199

1-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸

5 塩

MS:m/e (ESI) 464. 3 (MH+)

実施例 2200

1-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 399. 2 (MH+)

実施例 2201

2-[2-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 458. 3 (MH+)

実施例 2202

6-[2-(3-クロロ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 460. 3 (MH+)

実施例 2203

2-[2-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 505. 3 (MH+)

実施例 2204

1-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 508. 3 (MH⁺)

5 実施例 2205

1-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 443. 2 (MH⁺)

実施例 2206

10 2-[2-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502. 3 (MH⁺)

実施例 2207

15 6-[2-(3-ブロモ-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 504. 3 (MH⁺)

実施例 2208

20 2-[2-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 508. 3 (MH⁺)

実施例 2209

25 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-エタノ

ン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 513. 3 (MH+)

実施例 2210

5 1-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(7-フルオ
ロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 485. 3 (MH+)

実施例 2211

10 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
ル)-1-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-エタノ
ン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 448. 3 (MH+)

実施例 2212

15 6-ジメチルアミノ-2-[2-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-
フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カ
ルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 4 (MH+)

実施例 2213

20 6-[2-(3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキシ
-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カ
ルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 508. 3 (MH+)

実施例 2214

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-エトキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 565. 0 (MH+)

実施例 2215

5 1-[3-第 3 ブチル-5-(4-エトキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 570. 0 (MH+)

実施例 2216

10 1-[3-第 3 ブチル-5-(4-エトキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 0 (MH+)

実施例 2217

15 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 0 (MH+)

実施例 2218

20 1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 0 (MH+)

実施例 2219

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 536. 1 (MH+)

実施例 2220

6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 538.1 (MH⁺)

実施例 2221

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 514.0 (MH⁺)

実施例 2222

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 476.3 (MH⁺)

実施例 2223

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 471.8 (MH⁺)

実施例 2224

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 443.9 (MH⁺)

実施例 2225

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-メチルアミノ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 407.0 (MH⁺)

5 実施例 2226

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 545.0 (MH⁺)

10 実施例 2227

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551.0 (MH⁺)

15 実施例 2228

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522.9 (MH⁺)

20 実施例 2229

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486.0 (MH⁺)

25 実施例 2230

メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-

メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 546.0 (MH⁺)

実施例 2231

- 5 メタンスルホン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 547.0 (MH⁺)

実施例 2232

- 10 2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521.3 (MH⁺)

実施例 2233

- 15 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526.3 (MH⁺)

実施例 2234

- 20 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498.3 (MH⁺)

実施例 2235

- 25 1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水

素酸塩

MS:m/e (ESI) 461. 3 (MH+)

実施例 2236

5 6-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-チアゾール-2-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボ
ン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522. 4 (MH+)

実施例 2237

10 2-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 ブチル-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-インドル-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509. 4 (MH+)

実施例 2238

15 N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514. 4 (MH+)

実施例 2239

20 N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-インドル-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486. 4 (MH+)

実施例 2240

25 N-{3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-N-メチル-アセトアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 449. 4 (MH+)

実施例 2241

6-{2-[3-(アセチル-メチル-アミノ)-5-第 3 ブチル-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 510. 5 (MH+)

実施例 2242

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 508. 0 (MH+)

実施例 2243

1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 514. 0 (MH+)

実施例 2244

1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 486. 0 (MH+)

実施例 2245

1-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 449. 0 (MH+)

実施例 2246

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 509.1 (MH⁺)

実施例 2247

6-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジエチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 510.1 (MH⁺)

実施例 2248

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 493.8 (MH⁺)

実施例 2249

1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 499.9 (MH⁺)

実施例 2250

1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 471.9 (MH⁺)

実施例 2251

1-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 435. 0 (MH+)

5 実施例 2252

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 0 (MH+)

10 実施例 2253

6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(エチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 0 (MH+)

15 実施例 2254

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 3 (MH+)

20 実施例 2255

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510. 4 (MH+)

25 実施例 2256

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ

-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 482.3 (MH⁺)

実施例 2257

- 5 1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 445.4 (MH⁺)

実施例 2258

- 10 6-[2-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-オキサゾール-5-イル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506.4 (MH⁺)

実施例 2259

- 15 2-{2-[8-第3ブチル-4-(2-シアノ-エチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 517.8 (MH⁺)

実施例 2260

- 20 6-{2-[8-第3ブチル-4-(2-シアノ-エチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 519.0 (MH⁺)

実施例 2261

- 25 3-{8-第3ブチル-6-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イ

ル}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 0 (MH+)

実施例 2262

5 3-{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イ
ル}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523. 0 (MH+)

実施例 2263

10 3-{8-第3ブチル-6-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-
イル}-プロピオニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 485. 0 (MH+)

実施例 2264

15 2-{2-[8-第3ブチル-4-(2-シアノ-エチル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサ
ジン-6-イル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-
イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 517. 1 (MH+)

実施例 2265

20 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-ジメチルアミノ
-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセ
チル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 2 (MH+)

実施例 2266

25 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 550. 2 (MH+)

実施例 2267

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミ
ノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル

5 エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 521. 3 (MH+)

実施例 2268

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒ
ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-ジメチルアミノ-フェニル

10 エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 484. 9 (MH+)

実施例 2269

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミ
ノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フ

15 ェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 545. 2 (MH+)

実施例 2270

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-6-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミ
ノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセ

20 チル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 546. 0 (MH+)

実施例 2271

1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ピリジン-4-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ
-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水

25 素酸塩

MS:m/e (ESI) 520. 3 (MH+)

実施例 2272

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-ピリジン-4-イル-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 492. 2 (MH⁺)

実施例 2273

1-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-ピリジン-4-イル-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 455. 2 (MH⁺)

実施例 2274

6-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-ピリジン-4-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 516. 3 (MH⁺)

実施例 2275

2-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-7-フルオロ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 499. 2 (MH⁺)

実施例 2276

1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 472. 0 (MH⁺)

実施例 2277

6-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 468.0 (MH⁺)

5 実施例 2278

2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493.8 (MH⁺)

10 実施例 2279

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 499.9 (MH⁺)

15 実施例 2280

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 471.9 (MH⁺)

20 実施例 2281

1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 434.9 (MH⁺)

25 実施例 2282

2-[2-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

ル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミ
ド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 495. 0 (MH⁺)

実施例 2283

- 5 6-[2-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-エトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン
酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 0 (MH⁺)

実施例 2284

- 10 メタンスルホン酸 4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ
-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-ジメチルアミノ-6-メトキシ-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524. 3 (MH⁺)

実施例 2285

- 15 メタンスルホン酸 2-ジメチルアミノ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメト
キシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 3 (MH⁺)

実施例 2286

- 20 メタンスルホン酸 4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-ジメチルアミノ-6-メトキシ-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 459. 3 (MH⁺)

実施例 2287

- 25 メタンスルホン酸 2-ジメチルアミノ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカ
ルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキ

シ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 520. 3 (MH+)

実施例 2288

- 5 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバ
モイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル
エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 532. 0 (MH+)

実施例 2289

- 10 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル エス
テル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 537. 0 (MH+)

実施例 2290

- 15 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチル
カルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フ
ェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 531. 0 (MH+)

実施例 2291

- 20 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバ
モイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-
フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 533. 0 (MH+)

実施例 2292

- 25 メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ
-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル エス
テル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 509.0 (MH⁺)

実施例 2293

メタンスルホン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 472.0 (MH⁺)

実施例 2294

メタンスルホン酸 3-第3ブチル-5-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 532.1 (MH⁺)

実施例 2295

メタンスルホン酸 3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 537.1 (MH⁺)

実施例 2296

メタンスルホン酸 3-第3ブチル-5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 531.1 (MH⁺)

実施例 2297

メタンスルホン酸 3-第3ブチル-5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 533.1 (MH⁺)

実施例 2298

メタンスルホン酸 3-第 3 ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 509. 0 (MH⁺)

実施例 2299

メタンスルホン酸 3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 472. 0 (MH⁺)

実施例 2300

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 523. 4 (MH⁺)

実施例 2301

1-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 528. 5 (MH⁺)

実施例 2302

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 522. 5 (MH⁺)

実施例 2303

6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524. 5 (MH⁺)

5 実施例 2304

1-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 500. 4 (MH⁺)

10 実施例 2305

1-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
ル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 463. 4 (MH⁺)

15 実施例 2306

2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 485. 3 (MH⁺)

20 実施例 2307

6-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486. 4 (MH⁺)

25 実施例 2308

1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニ

ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 462.3 (MH⁺)

実施例 2309

- 5 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 490.4 (MH⁺)

実施例 2310

- 10 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 425.4 (MH⁺)

実施例 2311

- 15 6-ジメチルアミノ-2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-フルオロ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 484.4 (MH⁺)

実施例 2312

- 20 2-{2-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 497.4 (MH⁺)

実施例 2313

- 25 2-{2-[3-第3ブチル-5-(2-ヒドロキシ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 496. 4 (MH+)

実施例 2314

5 1-[3-第 3 ブチル-5-(2-ヒドロキシ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502. 4 (MH+)

実施例 2315

10 1-[3-第 3 ブチル-5-(2-ヒドロキシ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 474. 4 (MH+)

実施例 2316

15 1-[3-第 3 ブチル-5-(2-ヒドロキシ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 437. 4 (MH+)

実施例 2317

20 6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(2-ヒドロキシ-エチルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498. 4 (MH+)

実施例 2318

25 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511.5 (MH⁺)

実施例 2319

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5

MS:m/e (ESI) 510.5 (MH⁺)

実施例 2320

1-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

10

MS:m/e (ESI) 516.5 (MH⁺)

実施例 2321

1-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15

MS:m/e (ESI) 488.4 (MH⁺)

実施例 2322

1-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
ル)-エタノン;臭化水素酸塩

20

MS:m/e (ESI) 451.4 (MH⁺)

実施例 2323

6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3-ヒドロキシ-プロピルアミノ)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25

MS:m/e (ESI) 512.5 (MH⁺)

実施例 2324

2-[2-(3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 522. 5 (MH⁺)

実施例 2325

2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 465. 3 (MH⁺)

実施例 2326

6-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 466. 3 (MH⁺)

実施例 2327

1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 442. 3 (MH⁺)

実施例 2328

2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 470. 4 (MH⁺)

実施例 2329

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-エタノン;
臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 405. 4 (MH⁺)

5 実施例 2330

6-ジメチルアミノ-2-[2-(3-ジメチルアミノ-5-イソプロペニル-4-メトキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 464. 4 (MH⁺)

10 実施例 2331

エチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 538. 4 (MH⁺)

15 実施例 2332

エチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 544. 4 (MH⁺)

20 実施例 2333

エチルカルバミン酸 2-第3ブチル-6-エトキシ-4-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 516. 4 (MH⁺)

25 実施例 2334

エチルカルバミン酸 2-第3ブチル-4-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒ

ドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 479. 4 (MH+)

実施例 2335

- 5 エチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(5-エトキシ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 539. 5 (MH+)

実施例 2336

- 10 エチルカルバミン酸 2-第 3 ブチル-6-エトキシ-4-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-フェニル エステル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 540. 5 (MH+)

実施例 2337

- 15 1-(3-第 3 ブチル-5-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 444. 4 (MH+)

実施例 2338

- 20 2-[2-(7-ジメチルアミノ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 465. 4 (MH+)

実施例 2339

- 25 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(7-ジメチルアミノ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-

エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 470. 4 (MH+)

実施例 2340

- 5 6-ジメチルアミノ-2-[2-(7-ジメチルアミノ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 464. 4 (MH+)

実施例 2341

- 10 6-[2-(7-ジメチルアミノ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 466. 4 (MH+)

実施例 2342

- 15 1-(7-ジメチルアミノ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 442. 4 (MH+)

実施例 2343

- 20 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(7-ジメチルアミノ-3,3-ジメチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 405. 4 (MH+)

実施例 2344

- 25 2-[2-(3,3-ジメチル-7-メチルアミノ-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 451. 4 (MH+)

実施例 2345

2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 456. 4 (MH+)

実施例 2346

6-ジメチルアミノ-2-[2-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキシ-エチル]-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 450. 4 (MH+)

実施例 2347

6-[2-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-オキシ-エチル]-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 452. 4 (MH+)

実施例 2348

1-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 428. 4 (MH+)

実施例 2349

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-1-(3, 3-ジメチル-7-メチルアミノ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラン-5-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 391. 4 (MH+)

実施例 2350

2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 483. 2 (MH⁺)

実施例 2351

6-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 484. 2 (MH⁺)

実施例 2352

1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 460. 2 (MH⁺)

実施例 2353

2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 488. 3 (MH⁺)

実施例 2354

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 423. 3 (MH⁺)

実施例 2355

6-ジメチルアミノ-2-{2-[3-ジメチルアミノ-5-(1-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 482.3 (MH⁺)

5 実施例 2356

6-エトキシ-2-{2-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 523.2 (MH⁺)

10 実施例 2357

6-ジメチルアミノ-2-{2-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 522.2 (MH⁺)

15 実施例 2358

3-エトキシ-6-{2-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524.3 (MH⁺)

20 実施例 2359

2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 500.2 (MH⁺)

25 実施例 2360

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ

ル)-1-[3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-5-イソプロピル-4-メトキシ-フェニル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 463. 3 (MH⁺)

実施例 2361

- 5 (1-{5-[2-(5-ジメチルアミノ-1-イミノ-6-メチルカルバモイル-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 564. 2 (MH⁺)

実施例 2362

- 10 (1-{5-[2-(3-エトキシ-7-イミノ-2-メチルカルバモイル-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 566. 2 (MH⁺)

実施例 2363

- 15 (1-{5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 542. 2 (MH⁺)

実施例 2364

- 20 (1-{5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-3-イソプロピル-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-イル)-酢酸;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 2 (MH⁺)

実施例 2365

- 25 2-(2-{3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

ル-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 525. 2 (MH+)

実施例 2366

5 2-(2-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]}-フェニ
ニル)-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソイ
ンドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524. 3 (MH+)

実施例 2367

10 1-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]}-フェニ
ル)-2-(5, 6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 530. 3 (MH+)

実施例 2368

15 1-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]}-フェニ
ル)-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5, 6-ジメトキシ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502. 2 (MH+)

実施例 2369

20 1-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]}-フェニ
ル)-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-6-イ
ル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 465. 3 (MH+)

実施例 2370

25 6-(2-{3-第 3 ブチル-4-メトキシ-5-[(2-メトキシ-エチル)-メチル-アミノ]}-フェ
ニル)-2-オキソ-エチル)-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]
ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 3 (MH⁺)

実施例 2371

5 2-{2-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 497. 2 (MH⁺)

実施例 2372

10 6-{2-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 498. 2 (MH⁺)

実施例 2373

15 1-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニ
ル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 474. 1 (MH⁺)

実施例 2374

20 2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イ
ル)-1-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニ
ル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502. 2 (MH⁺)

実施例 2375

25 2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イ
ル)-1-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニ
ル]-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 437. 2 (MH⁺)

実施例 2376

6-ジメチルアミノ-2-{2-[3-ジメチルアミノ-4-メトキシ-5-(1-メトキシ-1-メチル-エチル)-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 496. 2 (MH+)

実施例 2377

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 539. 2 (MH+)

実施例 2378

1-[3-第 3 ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 544. 2 (MH+)

実施例 2379

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 538. 2 (MH+)

実施例 2380

6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 540. 2 (MH+)

実施例 2381

1-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 516. 2 (MH⁺)

5 実施例 2382

1-[3-第3ブチル-5-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 479. 2 (MH⁺)

10 実施例 2383

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 553. 1 (MH⁺)

15 実施例 2384

1-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 558. 1 (MH⁺)

20 実施例 2385

2-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 552. 2 (MH⁺)

25 実施例 2386

6-{2-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メト

キシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ
ロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 554. 2 (MH⁺)

実施例 2387

- 5 1-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ
-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインド
ール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 530. 2 (MH⁺)

実施例 2388

- 10 1-[3-第3ブチル-5-(3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ
-フェニル]-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジ
ン-6-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 2 (MH⁺)

実施例 2389

- 15 2-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール
-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 506. 2 (MH⁺)

実施例 2390

- 20 6-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピ
リジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 507. 2 (MH⁺)

実施例 2391

- 25 ([3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル]-メチル-アミノ)-アセ

トニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 483. 2 (MH+)

実施例 2392

5 ({3-第 3 ブチル-5-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イ
ソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-メチル-アミノ)-アセ
トニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 511. 3 (MH+)

実施例 2393

10 ({3-第 3 ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5, 7-ジヒドロ-ピロロ
[3, 4-b]ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-メチル-アミノ)-ア
セトニトリル;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 446. 2 (MH+)

実施例 2394

15 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(シアノメチル-メチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニ
ル]-2-オキシ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソイン
ドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 505. 2 (MH+)

実施例 2395

20 2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(シアノメチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ
-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2, 3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチル
アミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 492. 2 (MH+)

実施例 2396

25 6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(シアノメチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ
-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6, 7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3, 4-b]ピリジン-2-カ
ルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 493. 2 (MH+)

実施例 2397

{3-第3ブチル-5-[2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニルアミノ}-アセトニトリル;

5 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 469. 2 (MH+)

実施例 2398

{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イン
インドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニルアミノ}-アセトニトリル;

10 臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 497. 2 (MH+)

実施例 2399

{3-第3ブチル-5-[2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]
ピリジン-6-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニルアミノ}-アセトニトリル;臭

15 化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 432. 2 (MH+)

実施例 2400

2-{2-[3-第3ブチル-5-(シアノメチル-アミノ)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキシ
-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カル

20 ボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 491. 2 (MH+)

実施例 2401

2-{2-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキ
シ-フェニル]-2-オキシ-エチル}-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソイ

25 ンドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 551. 3 (MH+)

実施例 2402

2-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

5 MS:m/e (ESI) 550. 3 (MH⁺)

実施例 2403

6-{2-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-オキソ-エチル}-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

10 MS:m/e (ESI) 552. 3 (MH⁺)

実施例 2404

1-[3-第 3 ブチル-5-(4-ヒドロキシ-4-メチル-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

15 MS:m/e (ESI) 528. 2 (MH⁺)

実施例 2405

6-エトキシ-3-イミノ-2-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

20 MS:m/e (ESI) 509. 2 (MH⁺)

実施例 2406

6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-オキソ-エチル]-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

25 MS:m/e (ESI) 508. 2 (MH⁺)

実施例 2407

2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-エタノール;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 514.2 (MH⁺)

5 実施例 2408

2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-1-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-エタノール;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 486.2 (MH⁺)

10 実施例 2409

2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-イル)-1-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-エタノール;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 449.2 (MH⁺)

15 実施例 2410

3-エトキシ-7-イミノ-6-[2-(3-イソプロピル-4-メトキシ-5-モルフォリン-4-イル-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸 メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 510.2 (MH⁺)

20 実施例 2411

2-(2-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェニル}-2-オキシ-エチル)-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-酢酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 525.2 (MH⁺)

25 実施例 2412

2-(2-{3-第3ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシ-フ

エニル}-2-オキソ-エチル)-6-ジメチルアミノ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソ
インドール-5-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 524. 2 (MH⁺)

実施例 2413

- 5 1-{3-第 3 ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェ
ニル}-2-(5,6-ジエチキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 530. 2 (MH⁺)

実施例 2414

- 10 1-{3-第 3 ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェ
ニル}-2-(7-フルオロ-1-イミノ-5,6-ジメトキシ-1,3-ジヒドロ-イソインドール
-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 502. 2 (MH⁺)

実施例 2415

- 15 1-{3-第 3 ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシ-フェ
ニル}-2-(2-シクロプロピル-7-イミノ-5,7-ジヒドロ-ピロロ[3,4-b]ピリジン-6-
イル)-エタノン;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 465. 2 (MH⁺)

実施例 2416

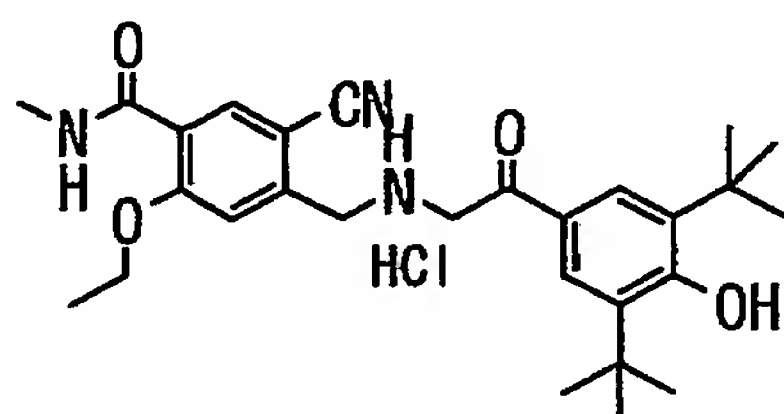
- 20 6-(2-{3-第 3 ブチル-5-[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-4-メトキシ-フ
エニル}-2-オキソ-エチル)-3-エトキシ-7-イミノ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ
[3,4-b]ピリジン-2-カルボン酸メチルアミド;臭化水素酸塩

MS:m/e (ESI) 526. 2 (MH⁺)

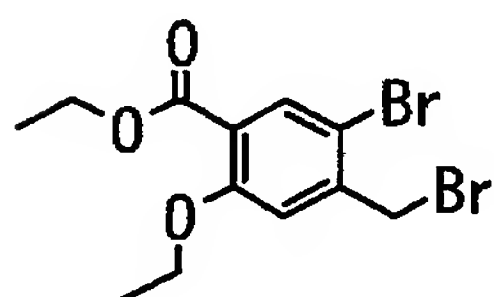
- 25 以下の実施例化合物は、上記各種 1-イミノイソインドリン誘導体の開環型のブ
ロドラッグ体として合成した。

<実施例 2417>

N1-メチル-5-シアノ-4-[(1-{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソエチル}アミノ)メチル]-2-エトキシベンズアミド;塩酸塩



5 (工程1) エチル 5-ブromo-4-(ブromoメチル)-2-エトキシベンゾエイト

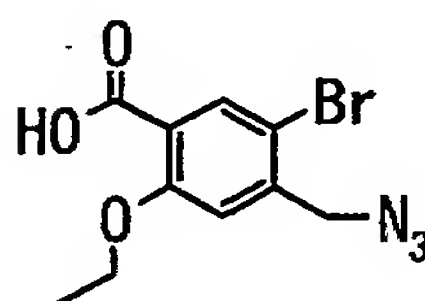


エチル 5-ブromo-2-エトキシ-4-メチルベンゾエイト 19.72g を四塩化炭素に溶解しアゾビスイソブチロニトリル(1.13g)を加え、30 分間加熱還流した。N-ブromosクシンイミドを加え、さらに1時間加熱還流した。反応液を濾過し、濾液を濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒：n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、標記化合物 10.54g を無色油状物として得た。

¹H-NMR(CDCl₃) δ (ppm)

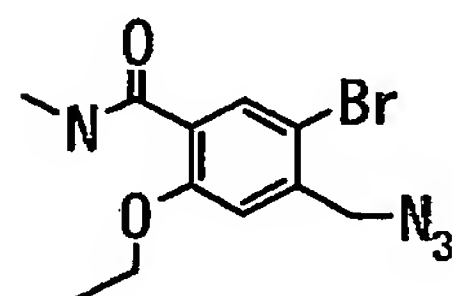
1.37(3H, t, J=7.2Hz), 1.46(3H, t, J=7.2H), 4.11(2H, q, J=7.2Hz), 4.35(2H, q, J=7.2Hz), 4.54(2H, s), 7.04(1H, s), 7.94(1H, s)

15 (工程2) 4-(アジドメチル)-5-ブromo-2-エトキシ安息香酸



- エチル 5-ブロモ-4-(ブロモメチル)-2-エトキシベンゾエイト 7.807g をジメチルホルムアミド(50ml)に溶解し、アジ化ナトリウム(2.0g)を加えた。室温にて終夜攪拌した。反応液を酢酸エチルに希釈し水、1N-塩酸、飽和食塩水にて洗浄し、有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、淡黄色油状物 6.96g を得た。このものをエタノール(100ml)に溶解し、5N-水酸化ナトリウムを加え 50°C にて 1 時間攪拌した。5N-塩酸(5ml)にて中和し、酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、淡黄色油状物 7.60g を得た。

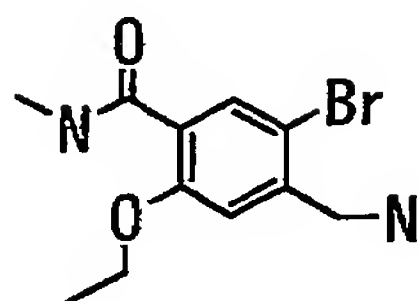
- ¹H-NMR (CDCl₃) δ (ppm)
1. 59 (3H, t, J=6.8Hz), 4.37 (2H, q, J=6.8Hz), 4.57 (2H, s), 7.14 (1H, s), 8.37 (1H, s)
- (工程 3) N1-メチル-4-(アジドメチル)-5-ブロモ-2-エトキシベンズアミド



- 4-(アジドメチル)-5-ブロモ-2-エトキシベンゾイック アシッド 7.67g をテトラヒドロフラン(100ml)に溶解し、トリエチルアミン(3.2ml)、クロロギ酸エチル(2.11ml)を順次加え室温にて 30 分攪拌した。メチルアミン水溶液(3.2ml)を加え、室温 30 分攪拌した。酢酸エチルにて希釈し水、1N-塩酸にて洗浄し有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し標記化合物 5.328g を白色固体を得た。

- ¹H-NMR (CDCl₃) δ (ppm)
- 1.53 (3H, t, J=6.8Hz), 3.00 (3H, d, J=4.8Hz), 4.23 (2H, q, J=7.2Hz), 4.51 (2H, s), 7.01 (1H, s), 7.88 (1H, br), 8.40 (1H, s)

(工程 4) N1-メチル-4-(アミノメチル)-5-ブロモ-2-エトキシベンズアミド

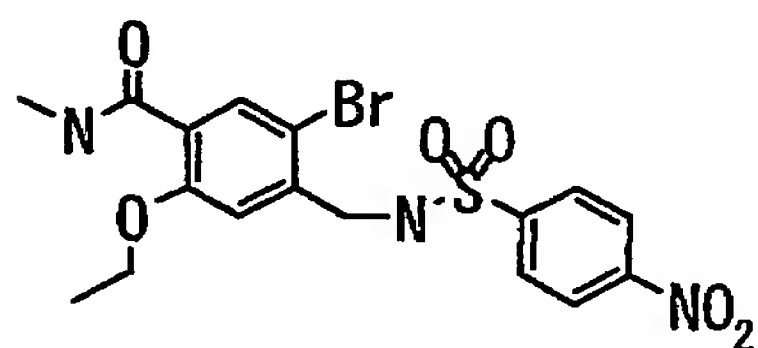


- 5 N1-メチル-4-(アジドメチル)-5-ブromo-2-エトキシベンズアミド 5.32g をテトラヒドロフラン(50ml)、水(3ml)に溶解し、トリフェニルフォスフィン(5.4g)を加えた。室温にて4日間攪拌した。反応液を濃縮し残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒：n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、
標記化合物 5.11g を淡黄色固体として得た。

¹H-NMR(CDC13) δ (ppm)

1.38(3H, t, J=7.2Hz), 2.79(3H, d, J=4.8Hz), 3.71(2H, s), 4.20(2H, q, J=7.2Hz), 7.34(1H, s), 7.84(1H, s), 8.03(1H, br)

- 10 (工程5) N1-メチル-5-ブromo-2-エトキシ-4-([(4-ニトロフェニル)スルフォニル]アミノ}メチル)ベンズアミド



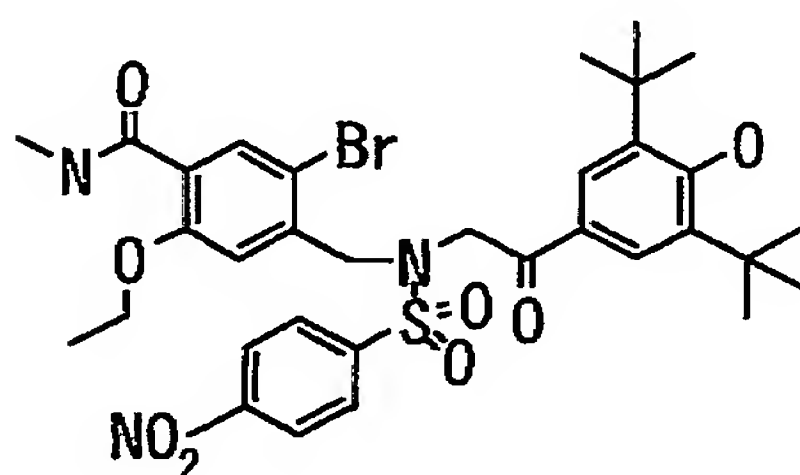
- 15 N1-メチル-4-(アミノメチル)-5-ブromo-2-エトキシベンズアミド (6.77g) をピリジン(50ml)に溶解し、4-ニトロベンゼンスルフォニルクロリド(5.3g)を加えた。室温にて終夜攪拌した。水、酢酸エチルを加え分液した。有機層を1N-塩酸、飽和食塩水にて順次洗浄し、析出した結晶を濾取した。(5.57g)濾液を有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、残渣を酢酸エチルにて洗浄、濾取し、
標記化合物をあわせて 8.31g を白色固体として得た。

¹H-NMR(CDC13) δ (ppm)

- 20 1.34(3H, t, J=9.2Hz), 2.76(3H, d, J=4.4Hz), 4.03(2H, q, J=7.2Hz), 4.16(2H, d, J=6.4

Hz), 7.03 (1H, s), 7.75 (1H, s), 7.96-8.02 (1H, m), 7.98 (2H, d, J=11.6Hz), 8.34 (2H, d, J=11.6Hz), 8.66-8.72 (1H, m)

(工程6) N1-メチル-5-ブロモ-4-({2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソエチル}[(4-ニトロフェニル)スルフォニル]アミノ)メチル)-2-エトキシベンズアミド

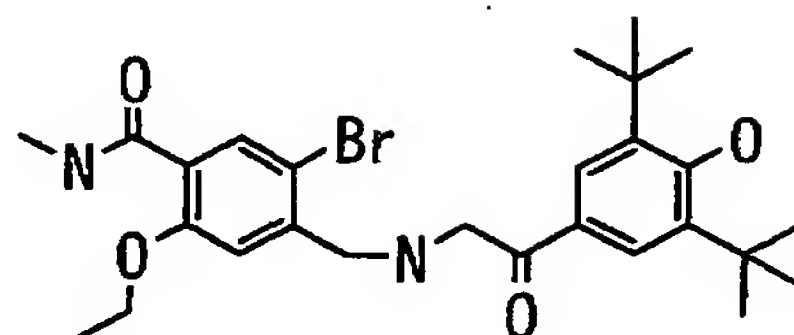


- 10 N1-メチル-5-ブロモ-2-エトキシ-4-({[(4-ニトロフェニル)スルフォニル]アミノ)メチル)ベンズアミド (2.10g) をアセトニトリル (20ml) に懸濁し、2-ブロモ-1-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-1-エタノン (1.74g)、炭酸セシウム (1.74g) を順次加えた。室温にて3日間攪拌し、酢酸エチルにて希釈、水、1N-塩酸にて洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテルにて洗浄、濾取し、標記化合物 3.04g を白色固体として得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ (ppm)

- 15 1.43 (18H, s), 1.51 (3H, t, J=6.8Hz), 3.00 (3H, d, J=4.8Hz), 4.18 (2H, q, J=6.8Hz), 4.65 (2H, s), 4.72 (2H, s), 5.82 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.61 (2H, s), 7.83-7.89 (1H, m), 8.05 (2H, d, J=11.6Hz), 8.32 (1H, s), 8.37 (2H, d, J=9.2Hz)

(工程7) N1-メチル-5-ブロモ-4-[(2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソエチル)アミノ)メチル]-2-エトキシベンズアミド

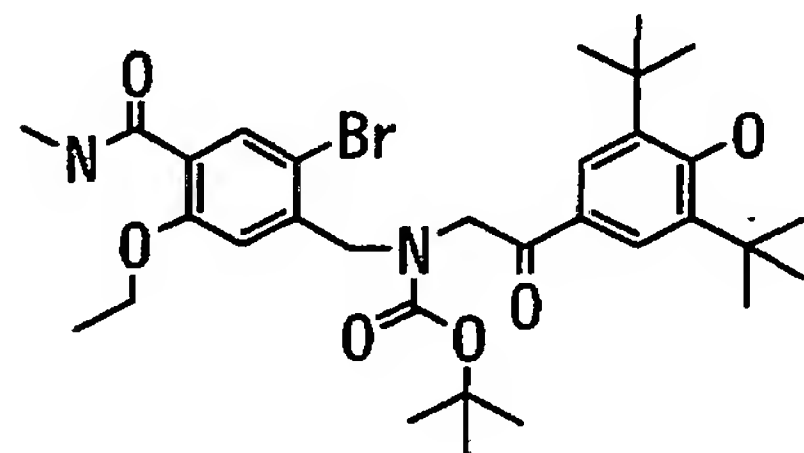


5 チオフェノール(1.27ml)をジメチルホルムアミド(20ml)に溶解し、水素化ナトリウム(480mg)を加えた。室温 30 分攪拌し、N1-メチル-5-ブromo-4-((2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキシエチル)[(4-ニトロフェニル)スルフォニル]アミノ)メチル)-2-エトキシベンズアミド(2.95g)を加えた。室温にて1時間攪拌し、酢酸エチルにて希釈、水、飽和食塩水にて洗浄し、有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥、濾過、濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒:n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、標記化合物 1.75g を淡橙色油状物として得た。(収率 78%)

10 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ (ppm)

1.42 (18H, s), 1.48 (3H, t, J=6.8Hz), 2.99 (3H, d, J=4.8Hz), 4.31 (2H, q, J=6.8Hz), 4.36 (2H, s), 4.42 (2H, s), 5.86 (1H, s), 7.73 (2H, s), 7.75 (1H, s), 7.93 (1H, brs), 8.39 (1H, d, J=3.6Hz)

15 (工程8) 第3ブチル N-{2-ブromo-5-エトキシ-4-[(メチルアミノ)カルボニル]ベンジル}-N-{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキシエチル}カーバメイト



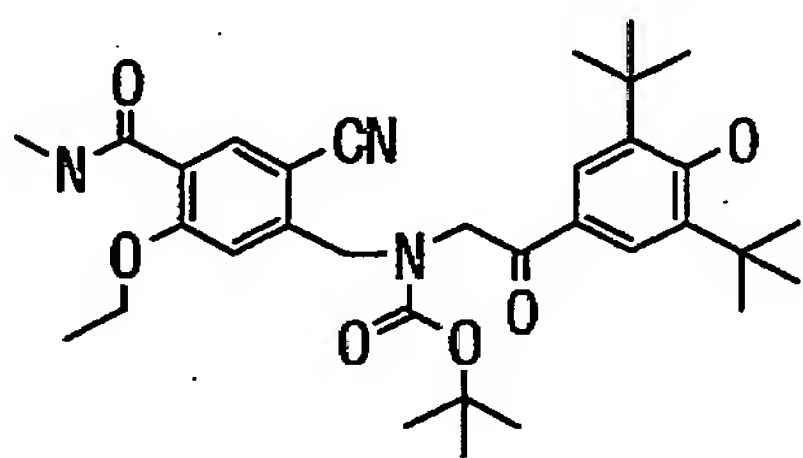
N1-メチル-5-ブromo-4-((2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキシエチル)アミノ)メチル)-2-エトキシベンズアミド(1.75g)をテトラヒドロ

フラン(20ml)に溶解し第三ブチルジカーボネート(770mg)を加えた。2時間加熱還流し、反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒:n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、標記化合物 1.97g を白色固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm)

- 5 1.42, 1.44, 1.46 (27H, each s), 1.50 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 3.00, 3.02 (3H, each d, $J=4.8\text{Hz}$ and $J=5.2\text{Hz}$), 4.15, 4.23 (2H, each q, $J=7.2\text{Hz}$ and 6.8Hz), 4.56, 4.57 (2H, each s), 4.63, 4.67 (2H, each s), 5.75 (1H, s), 7.12, 7.29 (1H, s), 7.72, 7.80 (2H, each s), 7.87-7.94 (1H, m), 8.32, 8.35 (1H, each s)

- 10 (工程9) 第3ブチル N-{2-シアノ-5-エトキシ-4-[(メチルアミノ)カルボニル]ベンジル}-N-{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキシエチル}カーバメイト



- 15 第3ブチル N-{2-ブromo-5-エトキシ-4-[(メチルアミノ)カルボニル]ベンジル}-N-{2-[3,5-ジ(第3ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキシエチル}カーバメイト (2.71g) をプロピオニトリル(11ml)に溶解し、窒素雰囲気下、シアン化ナトリウム(420mg)、よう化銅(163mg)、テトラキストリフェニルフォスフィンパラジウム(495mg)、を加え1時間加熱還流した。よう化銅(170mg)、テトラキストリフェニルフォスフィンパラジウム(500mg)を追加し更に4時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加えセライト濾過した。濾液を、水、飽和食塩水で洗浄した。
- 20 有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、不溶物を濾別後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒:n-ヘキサン-酢酸エチル)にて精製し、標記化合物 788mg を白色固体として得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ (ppm)

1. 38, 1. 41, 1. 45 (18H, each
s), 1. 54 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 57 (9H, s), 3. 00, 3. 01 (3H, each d, J=4. 4Hz and
J=4. 8Hz), 4. 29, 4. 36 (2H, each q, J=6. 8Hz), 4. 66, 4. 69 (2H, each
5 s), 4. 71, 4. 75 (2H, each s), 5. 76 (1H, s), 7. 47, 7. 51 (1H, each s), 7. 72, 7. 82 (2H, each
s), 7. 76-7. 82 (1H, m), 8. 46, 8. 50 (1H, each s)

(実施例 2417 : 最終工程)

- 第 3 ブチル N-{2-シアノ-5-エトキシ-4-[(メチルアミノ)カルボニル]ベンジ
ル}-N-{2-[3, 5-ジ(第 3 ブチル)-4-ヒドロキシフェニル]-2-オキソエチル}カー
10 バメイト (454mg) を 4N-塩化水素-ジオキサン溶液に溶解し、室温にて 1 時間攪拌
した。反応液を濃縮し、目的化合物 410mg を白色固体として得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ (ppm)

1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (18H, s), 2. 79 (3H, d, J=3. 6Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 3
8 (2H, brs), 4. 89 (2H, brs), 7. 74 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 8. 04 (1H, s), 8. 14 (1H, s), 8. 17 (1H, d, J=4. 8Hz)
15

実施例 2418

5-ブromo-4-{[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル
アミノ]-メチル}-2-エトキシ-3-フルオロ-N-メチル-ベンズアミド

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

- 20 1. 40 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 45 (18H, s), 3. 00 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 12 (4H, s), 4. 20 (2H, q, J
=7. 2Hz), 5. 76 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 7. 82 (1H, br), 8. 12 (1H, s).

実施例 2419

5-シアノ-4-{[2-(3, 5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシフェニル)-2-オキソ-エチル
アミノ]-メチル}-2-エトキシ-3-フルオロ-N-メチル-ベンズアミド

- 25 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 41 (18H, s), 2. 78 (3H, t, J=4. 4Hz), 4. 27 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 3

6 (2H, brs), 4. 89 (2H, brs), 7. 75 (2H, s), 8. 13 (1H, s), 8. 38-8. 42 (1H, m).

実施例 2420

5-シアノ-4-{[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチル
アミノ]-メチル}-2-エトキシ-N-メチル-ベンズアミド;塩酸塩

5 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 39 (3H, t, J=6. 8Hz), 1. 40 (18H, s), 2. 79 (3H, d, J=3. 6Hz), 4. 28 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 3
8 (2H, brs), 4. 89 (2H, brs), 7. 74 (2H, s), 7. 81 (1H, s), 8. 04 (1H, s), 8. 14 (1H, s), 8. 17 (
1H, d, J=4. 8Hz).

実施例 2421

10 4-({(2-アミノ-アセチル)-[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-
オキソ-エチル]-アミノ}-メチル)-5-シアノ-2-エトキシ-N-メチル-ベンズアミ
ド;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 36 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 40 (9H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 8Hz), 4. 22 (2H, q, J=7. 2Hz), 4. 46
15 (2H, brs), 4. 87 (2H, brs), 5. 20 (2H, brs), 7. 12 (1H, s), 7. 76 (2H, s), 8. 03 (1H, s), 8. 05
-8. 12 (1H, m), 8. 25 (1H, br).

実施例 2422

5-シアノ-4-({[2-(3,5-ジ-第3ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキソ-エチ
ル]-メチル-アミノ}-メチル)-2-エトキシ-N-メチル-ベンズアミド

20 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 33 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 37 (18H, s), 2. 36 (3H, s), 2. 77 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 86 (2H, s),
3. 98 (2H, s), 4. 10 (2H, q, J=7, 2Hz), 7. 25 (1H, s), 7. 70 (2H, s), 7. 78 (1H, brs), 7. 93 (1H
, s), 8. 03-8. 07 (1H, m).

実施例 2423

25 {2-第3ブチル-4-[2-(2-シアノ-5-エトキシ-4-メチルカルバモイル-ベンジルア
ミノ)-アセチル]-フェノキシ}-酢酸 メチルエステル;塩酸塩

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 31 (9H, s), 1. 38 (3H, t, J=6. 8Hz), 2. 76 (3H, d, J=4. 8Hz), 3. 25 (2H, d, J=7. 2Hz), 3. 70 (3H, s), 4. 19-4. 30 (2H, m), 4. 93 (2H, d, J=6. 4Hz), 5. 41 (1H, br), 6. 91 (1H, d, J=8. 8Hz), 7. 37 (1H, s), 7. 67 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 80 (1H, dd, J=2. 0, 8. 8Hz), 7. 82 (1H, s), 7. 98-8. 01 (1H, m), 8. 56 (2H, br).

実施例 2424

5-シアノ-4-([2-(3,5-ジ-第 3 ブチル-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-メチル-アミノ)-メチル)-2-エトキシ-ベンズアミド

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (3H, t, J=6. 4Hz), 1. 37 (9H, s), 2. 36 (3H, s), 3. 86 (2H, s), 3. 97 (2H, s), 4. 09 (2H, q, J=6. 4Hz), 7. 25 (1H, s), 7. 54 (1H, br), 7. 69 (2H, s), 7. 71 (1H, br), 7. 78 (1H, br), 7. 99 (1H, s).

実施例 2425

4-([2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル]-メチル-アミノ)-メチル]-5-シアノ-2-エトキシ-N-メチル-ベンズアミド

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1. 34 (3H, t, J=7. 2Hz), 1. 36 (9H, s), 1. 97 (2H, quint, J=6. 8Hz), 2. 29 (2H, t, J=6. 8Hz), 2. 35 (3H, s), 2. 79 (3H, d, J=4. 4Hz), 3. 88 (2H, s), 4. 00 (4H, m), 4. 12 (2H, q, J=7. 2Hz), 6. 83 (1H, s), 7. 28 (1H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 37 (1H, s), 7. 48 (1H, s), 7. 96 (1H, s), 8. 08 (1H, q, J=4. 4Hz), 9. 16 (1H, s).

実施例 2426

4-([2-[3-第 3 ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチル]-メチル-アミノ)-メチル]-5-シアノ-2-エトキシ-ベンズアミド

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.36 (12H, m), 1.98 (2H, quint, J=7.2Hz), 2.29 (2H, t, J=7.2Hz), 2.36 (3H, s), 3.88 (2H, s), 4.00 (4H, m), 4.12 (2H, q, J=6.8Hz), 6.83 (1H, s), 7.29 (1H, s), 7.33 (1H, s), 7.37 (1H, s), 7.47 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.73 (1H, s), 8.01 (1H, s), 9.16 (1H, s).

実施例 2427

5 4-(3-第3ブチル-5-{2-[(2-シアノ-5-エトキシ-ベンジル)-メチル-アミノ]}-アセチル}-2-ヒドロキシ-フェノキシ)-ブチルアミド

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.29 (3H, t, J=7Hz), 1.34 (9H, s), 1.92-2.01 (2H, m), 2.45-2.55 (2H, m), 2.55 (3H, s), 3.92-4.06 (4H, m), 4.15 (2H, q, J=7Hz), 5.38 (2H, s), 7.18-7.42 (2H, m), 7.45-7.66 (2H, m), 7.68-7.82 (2H, m).

実施例 2428

10 4-({2-[3-第3ブチル-5-(3-カルバモイル-プロポキシ)-4-ヒドロキシ-フェニル]-2-オキシ-エチルアミノ}-メチル)-5-シアノ-2-エトキシ-N-メチル-ベンズアミド;塩酸塩

15 ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

1.38 (9H, s), 1.40 (3H, t, J=6.8Hz), 1.99 (2H, t, J=6.8Hz), 2.29 (2H, t, J=6.8Hz), 2.79 (3H, d, J=4.8Hz), 4.05 (2H, t, J=6.4Hz), 4.29 (2H, q, J=6.8Hz), 4.38 (2H, brs), 4.88 (2H, brs), 6.81 (1H, brs), 7.36 (1H, brs), 7.42 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.86 (1H, s), 8.03 (1H, s), 8.18 (1H, q, J=3.6Hz), 9.51 (1H, brs).

20 試験例

本発明の化合物およびその塩の生化学的活性および医薬としての作用効果（トロンビン受容体結合能、血小板凝集抑制作用、平滑筋細胞の増殖抑制作用）を、以下の方法により評価した。

<試験例 1>

25 [レセプターバインディングアッセイ]

1週間以内に薬物を服用していない健常人より採血を行い、凝固阻止剤として

3.8%クエン酸（血液 9 に対して 1 の割合）を添加した。室温下、100g で 10 分間遠心することで多血小板血漿（PRP : platelet rich plasma）を得た。PRP を遠心して得た血小板沈渣を Dounce homogenizer でホモジナイズし、40,000g で 60 分間遠心し血小板膜を得た。得られた血小板膜は、10 mM MgCl_2 と 1 mM EGTA（エチレンジグリコール四酢酸）を含む 50 mM トリス塩酸緩衝液（緩衝液 1）に 1%の濃度になるように DMSO（ジメチルスルホキシド）を添加した溶液で懸濁し、 -80°C で保存した。緩衝液 1 にウシアルブミンおよび DMSO をそれぞれ 0.1%および 20% となるように添加して、被検化合物の調製液とした。この調製液で種々の濃度に希釈した被検化合物（ $20\mu\text{l}$ ）を 96 穴のマルチスクリーンプレートに添加した。

その後、緩衝液 1 にて希釈した 25 nM の $[^3\text{H}]\text{Ala}-(4\text{-fluoro})\text{Phe-Arg}-(\text{cyclohexyl})\text{Ala}-(\text{homo})\text{Arg-Tyr-NH}_2$ (high affinity TRAP) $80\mu\text{l}$ を添加して良く混和した。さらに、あらかじめ調製しておいた血小板膜溶液（0.4 mg/ml） $100\mu\text{l}$ を添加して混和した後、 37°C で 1 時間インキュベーションした。反応液を吸引濾過後に、 $200\mu\text{l}$ の緩衝液 1 にて三回洗浄した。その後、液体シンチレーター $30\mu\text{l}$ を添加してトップカウンター（パッカード）によりプレートの放射活性を測定し、被検化合物存在時の放射活性から非特異的結合分を差し引いた値を、特異的結合値（化合物非存在時の結合から非特異的結合分を差し引いた値）で除することにより結合率を求め、 IC_{50} 値を算出した。なお、非特異的な結合は $10\mu\text{M}$ の high affinity TRAP を添加した値とした。得られた結果を表 1～表 4 に示す。

20 <試験例 2>

[多血小板血漿を利用した血小板凝集抑制作用]

1 週間以内に薬物を服用していない健常人より採血を行い、凝固阻止剤として 3.8%クエン酸（血液 9 に対して 1 の割合）を添加した。室温下、100g で 10 分間遠心することで多血小板血漿（PRP : platelet rich plasma）を得た。PRP を除去した血液をさらに 1000g で 10 分間遠心することで乏血小板血漿（PPP : platelet poor plasma）を得た。血小板数は、多項目自動血球計数装置（K4500、シスメッ

クス) で測定し、約 30 万/ μ l となるように PRP を PPP で希釈した。血小板凝集能は、アグリゴメーター (エムシーメディカル) を用いて次のようにして調べた。PRP (175 μ l) に Fibrin 重合阻止剤として GPRP-NH₂ (最終濃度 1mM、25 μ l) を添加し、さらに Ca 非含有タイロイド液 (コントロール) あるいは種々の濃度の被験化合物溶液 (25 μ l) を添加して 37°C で 3 分間保温した後、25 μ l の最大凝集を引き起こす最小濃度のトロンビン (最終濃度: 0.5~1.5 units/ml のうちの至適濃度) を加え血小板凝集を惹起した。実験によっては、PRP と Ca 非含有タイロイド液 (コントロール) あるいは種々の濃度の検体調製液をあらかじめ 37°C で 60 分間プレインキュベーションを行った後、血小板凝集の反応を行った。トロンビン添加後、6 分間の凝集反応を調べ、凝集曲線の曲線下面積を比較することにより抑制率を求め、IC₅₀ 値を算出した。得られた結果を表 1 ~ 表 4 に示す。

< 試験例 3 >

[ラット平滑筋細胞増殖アッセイ]

雄性 SD ラット大動脈から explant 法にて血管平滑筋細胞 (rSMC) を単離した。増殖培地には、10% の牛胎児血清 (GibcoBRL)、ストレプトマイシンおよびペニシリンを含む DMEM 培地 (Sigma) を用い、37°C、5%CO₂ 存在下で継代培養した。増殖培地にて 1 x 10⁴ cells/ml の濃度に懸濁した rSMC100 μ l を 96 穴プレートに加え培養を開始した。三日後に DMEM 培地 100 μ l にて二回洗浄した後、培地を 0.1% アルブミンを含む DMEM 培地 (飢餓培地) 100 μ l に交換して血清飢餓を開始した。血清飢餓二日後に培地を交換し、飢餓培地 80 μ l および飢餓培地にて種々の濃度に希釈した被検化合物の 10 μ l を添加し、さらに飢餓培地で溶解したトロンビン (最終濃度 0.1units/ml) 10 μ l を添加してさらに 2 日間インキュベーションした。

7.5mg/ml となるように DPBS で溶解した MTT (3-[4,5-dimethylthiazol-2-yl]-2,5-diphenyl-tetrazolium bromide) を 20 μ l 添加し、さらに 4 時間インキュベーションを行った。培地を吸引除去して 50 μ l の 10%SDS/0.029% ammonia 溶液

- を添加して CO₂ インキュベーター内で 2 時間静置して細胞を完全に溶解した。細胞増殖の指標として OD590nm をプレートリーダー (EL340、BIO-TEK instruments Inc.) で測定し、コントロール OD 値 (化合物非存在時の OD 値) から被検化合物存在時の OD 値を差し引いた値を、コントロール OD 値からブランク OD 値 (トロンビン非刺激での OD 値) を差し引いた値で除することにより抑制率を求め、
- 5 IC₅₀ 値を算出した。得られた結果を表 1 ～表 4 に示す。

表 1

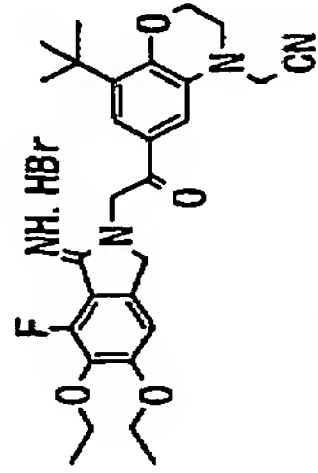
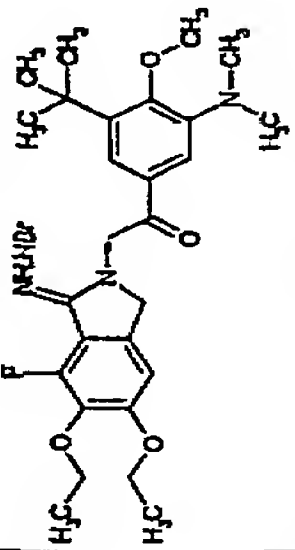
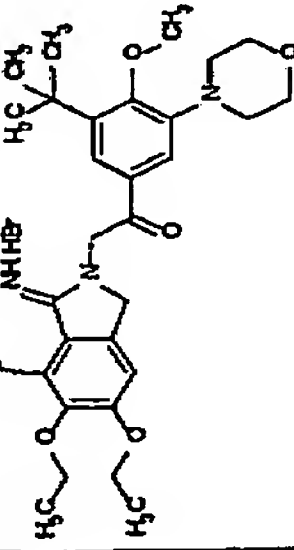
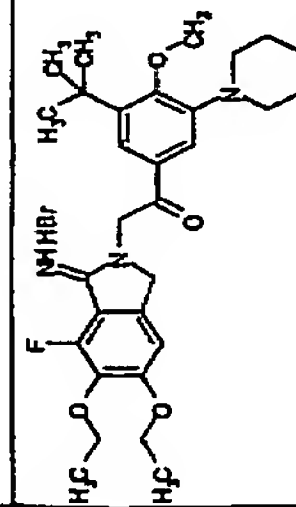
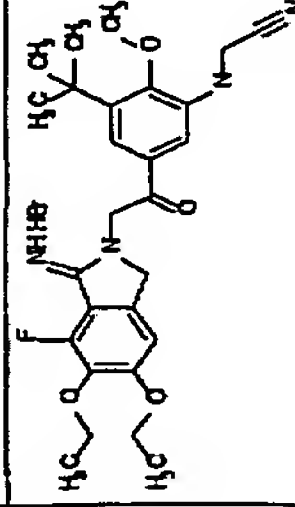
実施例 No.	化合物	化合物名	RBA IC ₅₀ (μ M)	Thr IC ₅₀ (μ M)	Rat SMC IC ₅₀ (μ M)
実施例 5		{8-第3ブチル-6-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]オキサジン-4-イル}-アセトニトリル;臭化水素酸塩	0.017	0.29	0.0061
実施例 6		1-(3-第3ブチル-5-ジメチルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩	0.024	0.072	0.019
実施例 7		1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-モルフォリノ-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩	0.026	0.041	0.032
実施例 8		1-[3-第3ブチル-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン;臭化水素酸塩	0.029	0.084	0.023
実施例 10		{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-2-メトキシアミノ}-アセトニトリル;臭化水素酸塩	0.026	0.024	0.034

表 2

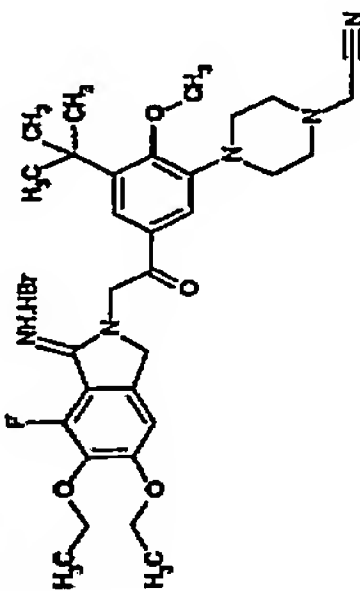
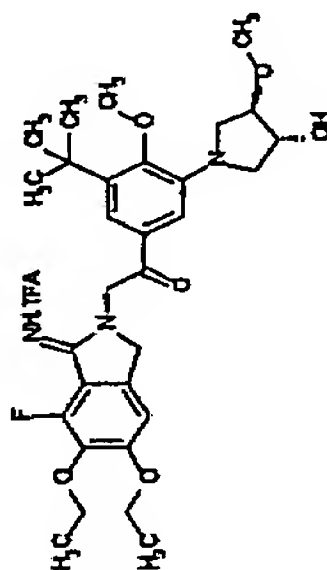
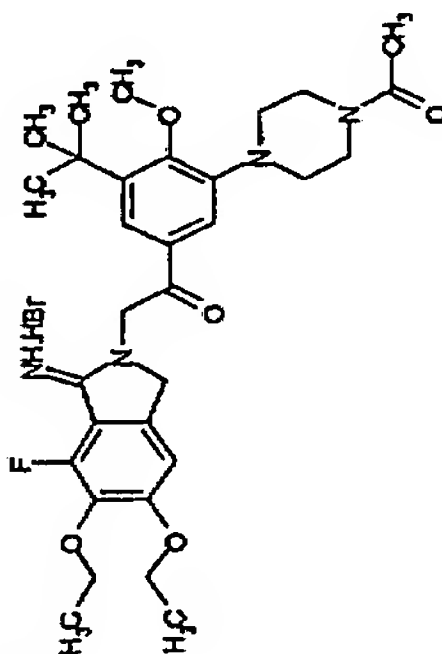
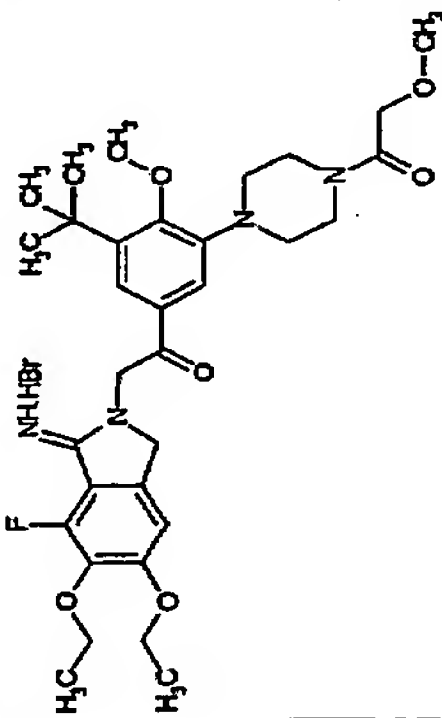
実施例 No.	化合物	化合物名	RBA IC ₅₀ (μ M)	Thr IC ₅₀ (μ M)	Rat SMC IC ₅₀ (μ M)
実施例 11		(4-{3-第3ブチル-5-[2-5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペラジン-1-イル)-アセトニトリル; 臭化水素酸塩	0.045	0.057	0.075
実施例 12		1-[3-第3ブチル-5-((3R,4R)-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩	0.045	0.041	0.021
実施例 13		1-[3-(4-アセチル-ピペラジン-1-イル)-5-第3ブチル-4-メトキシ-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩	0.046	0.045	0.12
実施例 16		1-[3-第3ブチル-4-メトキシ-5-[4-(2-メトキシ-アセチル)-ピペラジン-1-イル]-フェニル]-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩	0.053	0.057	0.059

表 3

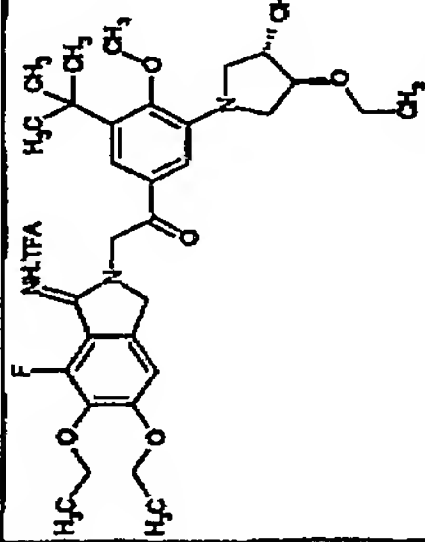
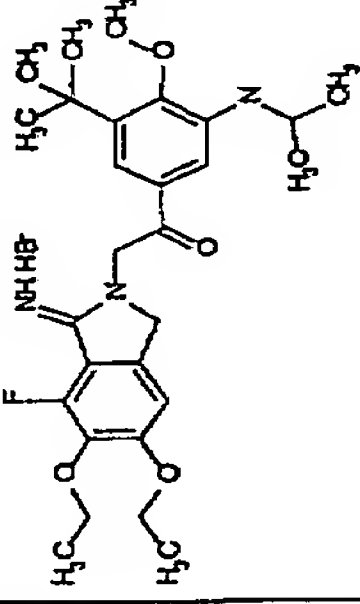
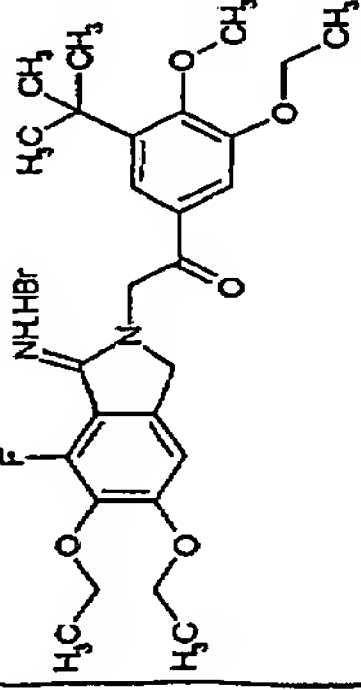
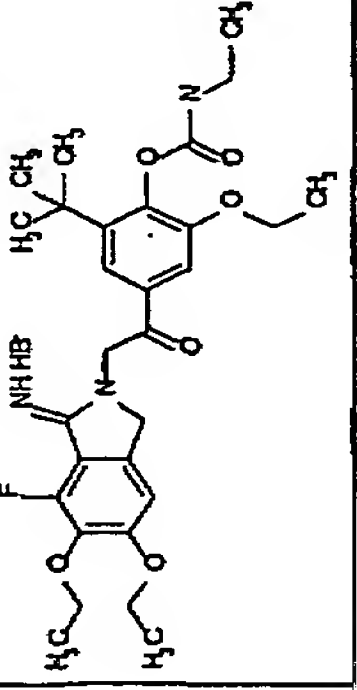
実施例 No.	化合物	化合物名	RBA IC ₅₀ (μ M)	Thr IC ₅₀ (μ M)	Rat SMC IC ₅₀ (μ M)
実施例 17		1-[3-第 3 ブチル-5-((3S, 4S)-3-エトキシ-4-ヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-4-メトキシ-フェニル]-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン; トリフルオロ酢酸塩	0.032	0.08	—
実施例 26		1-(3-第 3 ブチル-5-イソプロピルアミノ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩	0.017	0.079	0.062
実施例 28		1-(3-第 3 ブチル-5-エトキシ-4-メトキシ-フェニル)-2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-エタノン; 臭化水素酸塩	0.026	0.044	0.05
実施例 29		エチル-カルバミン酸 2-第 3 ブチル-4-[2-(5, 6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1, 3-ジヒドロ-イソインドル-2-イル)-アセチル]-6-エトキシ-フェニル エステル; 臭化水素酸塩	0.076	0.052	0.07

表 4

実施例 No.	化合物	化合物名	RBA IC ₅₀ (μ M)	Thr IC ₅₀ (μ M)	Rat SMC IC ₅₀ (μ M)
実施例 94		1-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ピペリジン-4-オン; 臭化水素酸塩	0.013	0.029	0.044
実施例 109		2-[2-(3-第3ブチル-5-エトキシ-4-ヒドロキシ-フェニル)-2-オキシ-エチル]-6-エトキシ-3-イミノ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-カルボン酸メチルアミド; 臭化水素酸塩	0.03	0.012	0.042
実施例 112		1-(3-第3ブチル-4-メトキシ-5-ヒペラジン-1-イル-フェニル)-2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-エタノン; 2塩酸塩	0.03	0.028	0.052
実施例 127		(4-{3-第3ブチル-5-[2-(5,6-ジエトキシ-7-フルオロ-1-イミノ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-アセチル]-2-メトキシ-フェニル}-ヒペラジン-1-イル)-酢酸; 2塩酸塩	0.017	0.021	0.15

本発明の化合物およびその塩は、試験例 1 において優れたトロンビン受容体結合能を示し、特にトロンビンの PAR 1 受容体に対して選択的な結合能を示した。また、本発明の化合物およびその塩は、試験例 2 において優れた血小板凝集抑制作用を示した。さらに、本発明の化合物およびその塩は、試験例 3 において優れた平滑筋細胞の増殖抑制作用を示した。

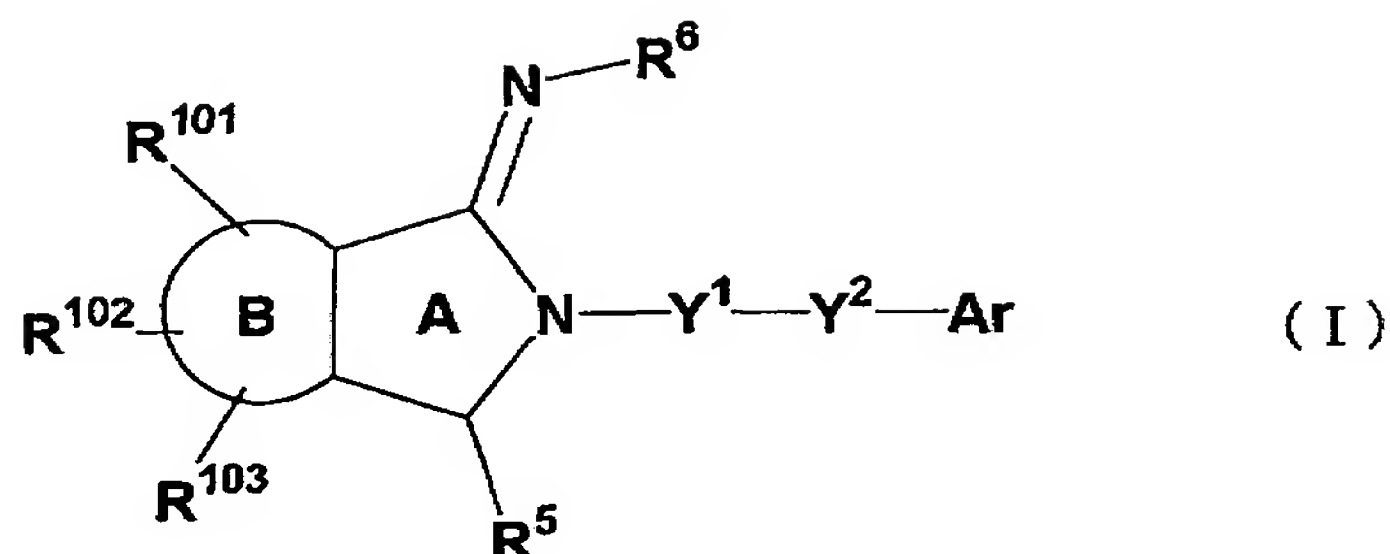
産業上の利用可能性

本発明により、前記式 (I) で表わされる新規な 2-イミノピロリジン誘導体およびその塩を提供することができる。そして、前記式 (I) で表わされる本発明の化合物およびその塩は、優れたトロンビン受容体拮抗作用を有し、特にトロンビンの PAR 1 受容体に対して選択的に拮抗作用を示すものである。従って、本発明の化合物またはその塩によれば、トロンビンのフィブリノーゲンをフィブリンに変換する触媒活性を阻害することなくトロンビンによる血小板凝集などの細胞応答を抑制することができ、また、冠動脈血管形成術等により血管壁に損傷が生じたときに起こる血管平滑筋増殖に対しても PAR 1 選択的阻害に基づいて抑制することが可能となる。

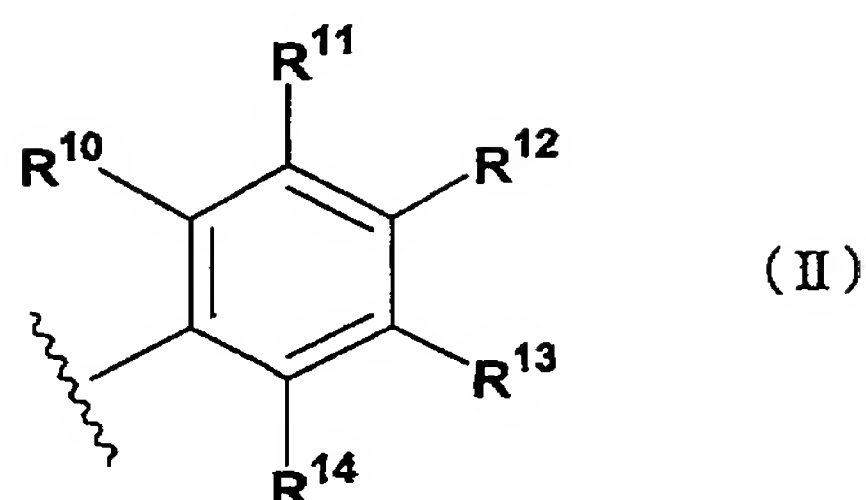
よって、本発明の化合物またはその塩は、トロンビン受容体の拮抗剤（特にトロンビンの PAR 1 受容体の拮抗剤）、血小板凝集阻害剤（抗血栓薬）、平滑筋細胞の増殖阻害剤として有用であり、また、血管形成術中または術後の再狭窄、不安定狭心症、安定狭心症、心筋梗塞、脳梗塞、末梢動脈閉塞等の治療薬または予防薬として有用であり、更に、深部静脈血栓症、肺塞栓症、心房細動に伴う脳塞栓症等の静脈性血栓症、糸球体腎炎症候群等の治療薬または予防薬や、抗炎症剤、抗再狭窄剤としても有用である。

請求の範囲

1. 式



- [式中、B環はそれぞれさらに置換基を有していてもよい(1)芳香族炭化水素環または(2) 1あるいは2個のNを含有しても良い芳香族複素環を； R^{101} 、 R^{102} および R^{103} は同一または相異なって(1)水素原子または(2)下記置換基群cから選ばれるいずれか1の基を； R^5 は(1)水素原子、(2)シアノ基、(3)ハロゲン原子または(4)下記置換基群aから選ばれるいずれか1の基を； R^6 は(1)水素原子、(2) C_{1-6} アルキル基、(3)アシル基、(4)カルバモイル基、(5)水酸基、(6) C_{1-6} アルコキシ基、(7) C_{1-6} アルキルオキシカルボニルオキシ基、(8) C_{3-8} 環状アルキル基、(9)アシルオキシ基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキルオキシカルボニル基または(10)それぞれ下記置換基群eから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基もしくは5乃至14員芳香族複素環式基を； Y^1 は単結合、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-CR^8-$ 、 $-CR^8R^9-$ 、 $-CH_2CO-$ 、 $-NR^8-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CO-$ 、 $-CONR^8-$ または $-SO_2NR^8-$ 〔式中、 m は1乃至3の整数を、 R^8 および R^9 は同一または相異なって水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、カルボキシル基または C_{1-6} アルコキシカルボニル基を示す〕を； Y^2 は単結合、O、N、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-CR^8-$ 、 CR^8R^9- 、 $-CO-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ または $-C(=N-OR^8)-$ 〔式中、 m 、 R^8 および R^9 は前記定義と同意義を示す〕を；Arは(1)水素原子、(2)式



- [式中、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} および R^{14} は同一または相異なって(1)水素原子、(2)シアノ基、(3)ハロゲン原子、(4)ニトロ基または(5)下記置換基群bから選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、 R^{11} と R^{12} 、または、 R^{12} と R^{13} は結合してN、SおよびOから選ばれる1乃至4個の複素原子を含有していてもよくかつ下記置換基群fから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい5乃至8員複素環を形成していてもよい。]で表わされる基または(3)下記置換基群gから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい5乃至14員芳香族複素環式基を示す。
- 10 <前記置換基群a>下記置換基群a'から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、アルキリデン基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、
- 15 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；
- <前記置換基群a'> C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8}
- 20

- 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン原子、 C_{3-8} 環状アルキル基、含ヘテロ環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群を示し、
- 5 更に、前記 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基は、それぞれ C_{1-6} アルキル基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレ
- 10 イド基、ウレニレン基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン原子および C_{3-8} 環状アルキル基からなる群より選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい；
- <前記置換基群b>下記置換基群b'から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル
- 15 基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アミノアルキル基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至
- 20 14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；
- <前記置換基群b'> C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、オキソ基、シアノ基、 C_{1-6} シアノアシル基、 C_{2-7} アシル基、 C_{1-6} アルカノイル基、ベンゾイル基、アララルカノイル基、 C_{1-6} アルコキシアルキルカルボ
- 25 ニル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキルカルボニル基、カルボキシル基、 C_{1-6} カルボキシルアルキル基、 C_{1-6} カルボキシルアルキルオキシ基、カルバモイル基、

- カルバモイルアルキルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-10} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル基、 C_{1-10} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキルオキシ基、 C_{1-6} モノアルキルアミノカルボニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-10} アルコキシアルキル基、 C_{1-10} アラルキルオキシアルキル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、 C_{1-6} モノアルキルアミノスルホニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミノスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基、含ヘテロ環状アミノカルボニル基、含ヘテロ環状アミノスルホニル基およびイソキサゾリニル基からなる群を示し、更に、前記5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基およびイソキサゾリニル基は、独立に、 C_{1-6} アルキル基、オキシ基、シアノ基、アシル基、カルボキシ基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-6} アミノアルキル基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} ジアルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、アルキルスルホニルアミノ基、アルキルスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン基および C_{3-8} 環状アルキル基からなる群より選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい；
- <前記置換基群 c> (1)シアノ基、(2)ハロゲン原子ならびに(3)下記置換基群 c' から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、 C_{2-8} アルケニル基、 C_{2-8} アルキニル基、アシル基、カルボキシ基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニ

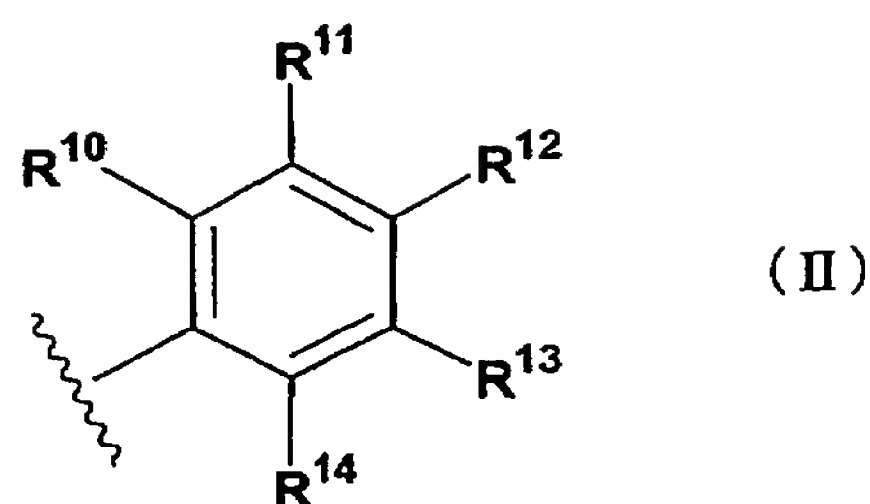
- ル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；
- 5 <前記置換基群 c' > C_{1-6} アルキル基、 C_{2-8} アルケニル基、 C_{2-8} アルキニル基、シアノ基、アシル基、カルボキシ基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；
- 10 <前記置換基群 e > C_{1-6} アルキル基、シアノ基、アシル基、カルボキシ基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン原子および C_{3-8} 環状アルキル基からなる群；
- 15 <前記置換基群 f > (1)水素原子、(2)シアノ基、(3)ハロゲン原子、(4)オキソ基ならびに(5)それぞれ下記置換基群 f' から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アシル基、 C_{1-6} アルカノイル基、カルボキシ基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン原子および C_{3-8} 環状アルキル基からなる群；
- 20 <前記置換基群 f' > (1)水素原子、(2)シアノ基、(3)ハロゲン原子、(4)オキソ基ならびに(5)それぞれ下記置換基群 f' から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アシル基、 C_{1-6} アルカノイル基、カルボキシ基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、イミノ基、 C_{1-6} アミノアルキル基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、
- 25

スルホニルアミノ基、スルホニル基、スルファモイル基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；

- 5 <前記置換基群 f' > C_{1-6} アルキル基、オキシ基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレニレン基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、スルファモイル基、
- 10 ハロゲノ基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；
- <前記置換基群 g > C_{1-6} アルキル基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基および C_{3-8} 環状アルキル基からなる群。]
- 15

で表わされる化合物またはその塩。

2. B環はそれぞれさらに置換基を有していてもよいベンゼン環またはピリジン環を； R^{101} 、 R^{102} および R^{103} は同一または相異なって水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基および C_{3-8} 環状アルキル基からなる群から選ばれるいずれか1の基を； R^5 は水素原子、 C_{1-6} アルキル基および C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基からなる群から選ばれるいずれか1の基を； R^6 は水素原子、 C_{1-6} アルキル基およびアシルオキシ基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキルオキシカルボニル基からなる群から選ばれるいずれか1の基を； Y^1 は単結合または $-(CH_2)_m-$ 〔式中、 m は1乃至3の整数を示す〕を； Y^2 は単結合または $-CO-$ を； A_r は水素原子または式
- 20
- 25



〔式中、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} および R^{14} は同一または相異なって水素原子、 C_{1-6} アルキル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、5乃至14員非芳香族複素環式基および C_{1-6} アルキルオキシカルボニルオキシ基からなる群から選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、 R^{11} と R^{12} 、または、 R^{12} と R^{13} は結合して、(i)N、SおよびOから選ばれる1乃至4個の複素原子を含有していてもよく、かつ(ii)シアノ基、オキシ基ならびにそれぞれ下記置換基群 f'' ：

＜前記置換基群 f'' ＞ C_{1-6} アルキル基、オキシ基、シアノ基、アシル基、カルボキシル基および C_{1-6} アルコキシ基からなる群；

から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、アシル基、 C_{1-6} アルカノイル基、カルボキシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、スルホニル基および5乃至14員非芳香族複素環式基からなる群から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい、5乃至8員複素環を形成していてもよい。〕で表わされる基を示す、請求項1記載の化合物またはその塩。

3. B環が置換基を有していてもよいベンゼン環である請求項1記載の化合物またはその塩。

4. Y^1 が $-CH_2-$ である請求項1記載の化合物またはその塩。

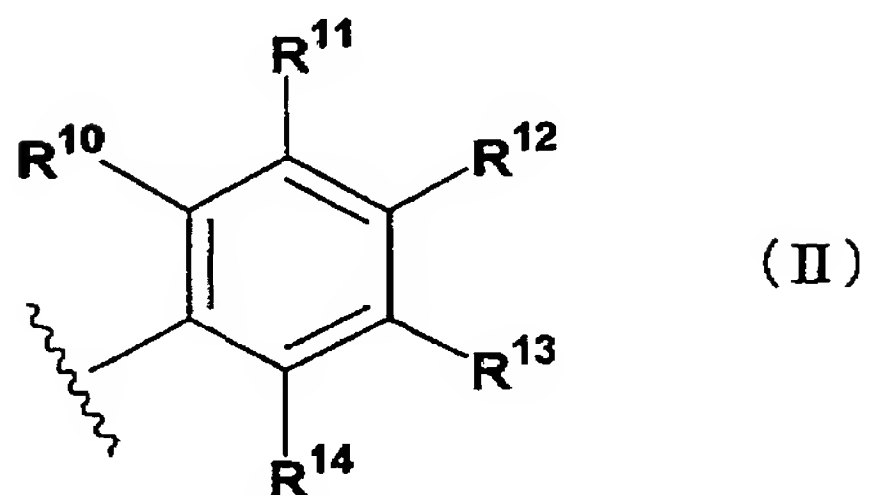
5. Y^2 が $-CO-$ である請求項1記載の化合物またはその塩。

6. Y^1 が $-CH_2-$ で、 Y^2 が $-CO-$ である請求項1記載の化合物または

その塩。

7. Y^1 が単結合で、 Y^2 が単結合で、 A_r が水素原子である請求項1記載の化合物またはその塩。

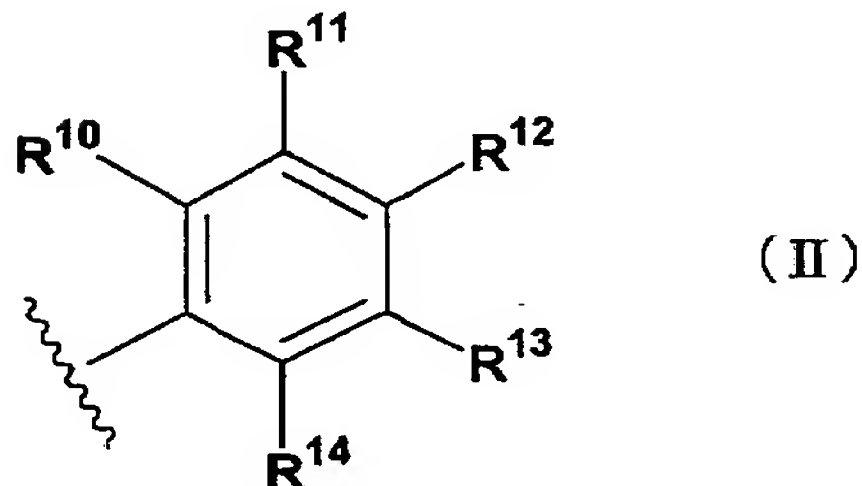
8. A_r が式



[式中、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} および R^{14} は前記定義と同意義を示す。]で表わされる基である請求項1記載の化合物またはその塩。

9. R^{10} および R^{14} が水素原子である請求項8記載の化合物またはその塩。

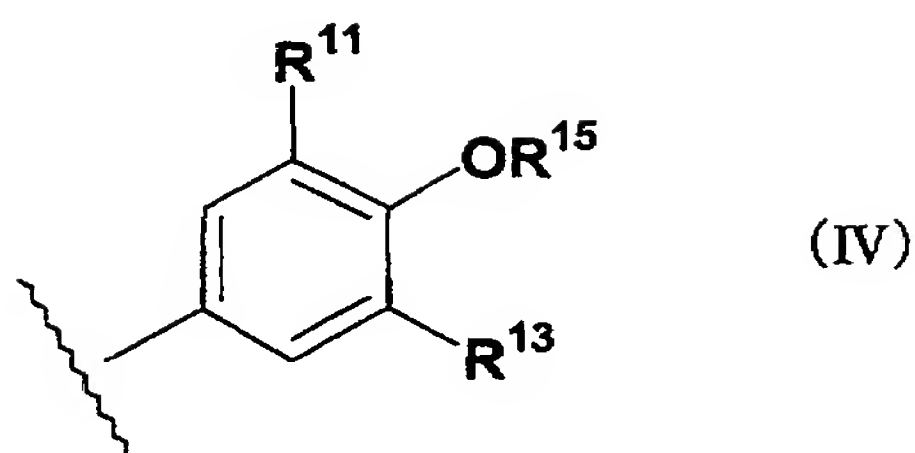
10. A_r が(1)式



[式中、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} および R^{14} はそれぞれ前記定義と同意義を示す。]で表わされる基または(2)前記置換基群gから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい5乃至14員芳香族複素環式基である請求項1記載の化合物またはその塩。

15 11. R^{10} および R^{14} が水素原子である請求項10記載の化合物またはその塩。

12. A_r が式



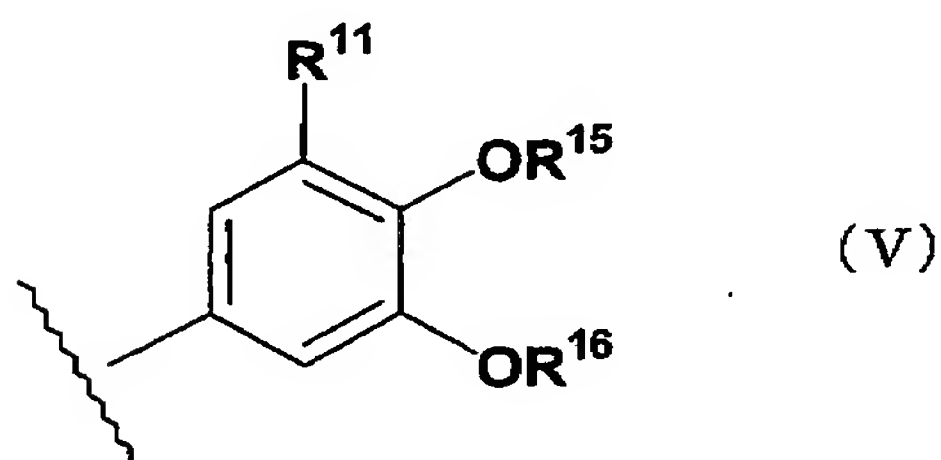
5 [式中、 R^{11} および R^{13} は前記定義と同意義を、 R^{15} は(1)水素原子または(2)下記置換基群hから選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、 R^{11} および R^{15} は結合して前記置換基群fから選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよくN、SおよびOから選ばれる1または2個の複素原子を含有していてもよい5乃至8員複素環を形成してもよい。

10 <前記置換基群h>下記置換基群h'から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、アシル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、 C_{3-8} 環状アルキル基、 C_{1-6} アミノアルキル基、スルホニル基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；
 15 <前記置換基群h'> C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、オキシ基、シアノ基、 C_{1-6} シアノアルキル基、 C_{2-7} アシル基、 C_{1-6} アルカノイル基、ベンゾイル基、アラルカノイル基、 C_{1-6} アルコキシアルキルカルボニル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキルカルボニル基、カルボキシ基、 C_{1-6} カルボキシアルキル基、 C_{1-6} カルボキシアルキルオキシ基、カルバモイル基、カルバモイルアルキルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-10} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル基、 C_{1-10} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル
 20 オキシ基、 C_{1-6} モノアルキルアミノカルボニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-10} アルコキシアルキル基、 C_{1-10} アラルキルオキシアルキル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基、 C_{3-8} 環状アル

- キルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、 C_{1-6} モノアルキルアミノスルホニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミノスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基、含ヘテロ環状アミノカルボニル基、含ヘテロ環状アミノスルホニル基およびイソキサゾリニル基からなる群を示し、更に、前記5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基およびイソキサゾリニル基は、独立に、 C_{1-6} アルキル基、オキシ基、シアノ基、アシル基、カルボキシ基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状アルキルオキシ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-6} アミノアルキル基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} ジアルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、アルキルスルホニルアミノ基、アルキルスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲン基および C_{3-8} 環状アルキル基からなる群から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい。]

で表される基である請求項1記載の化合物またはその塩。

13. Arが式

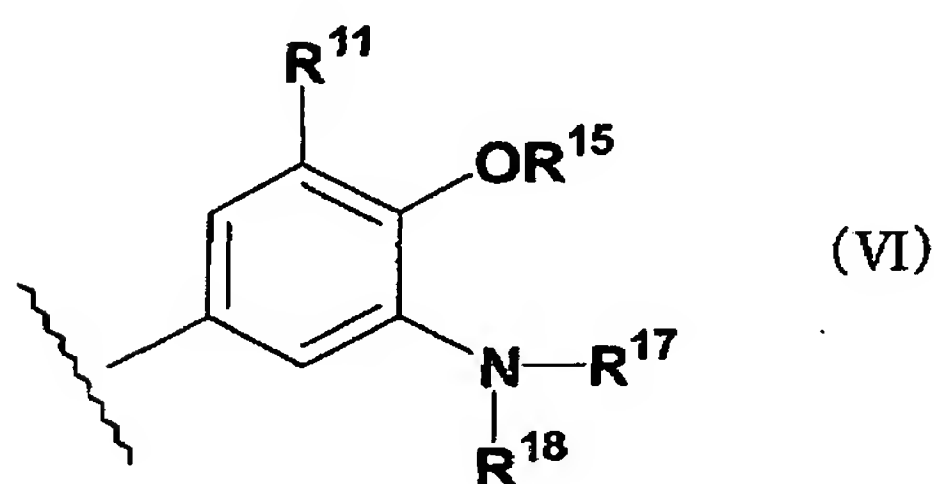


[式中、 R^{11} および R^{15} はそれぞれ前記定義と同意義を、 R^{16} は(1)水素原子または(2)前記置換基群hから選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、 R^{11} と R^{15}

⁵、または、 R^{15} と R^{16} が結合して前記置換基群 f から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよくN、SおよびOから選ばれる1または2個の複素原子を有していてもよい5乃至6員複素環を形成していてもよい。]

で表される基である請求項1記載の化合物またはその塩。

5 14. Ar が式



[式中、 R^{11} および R^{15} はそれぞれ前記定義と同意義を、 R^{17} および R^{18} は同一または相異なって(1)水素原子または(2)下記置換基群 i から選ばれるいずれか1の基を示し、さらに、 R^{11} と R^{15} 、 R^{15} と R^{17} 、 R^{15} と R^{18} 、または、 R^{17} と R^{18} は結合して前記置換基群 f から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよくN、SおよびOから選ばれる1または2個の複素原子を含有していてもよい5乃至8員複素環を形成してもよい。

10

15

<前記置換基群 i > 下記置換基群 i' から選ばれる少なくとも1の基でそれぞれ置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、アシル基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、 C_{1-6} アミノアルキル基、スルホニル基、スルファモイル基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基および5乃至14員芳香族複素環式基からなる群；

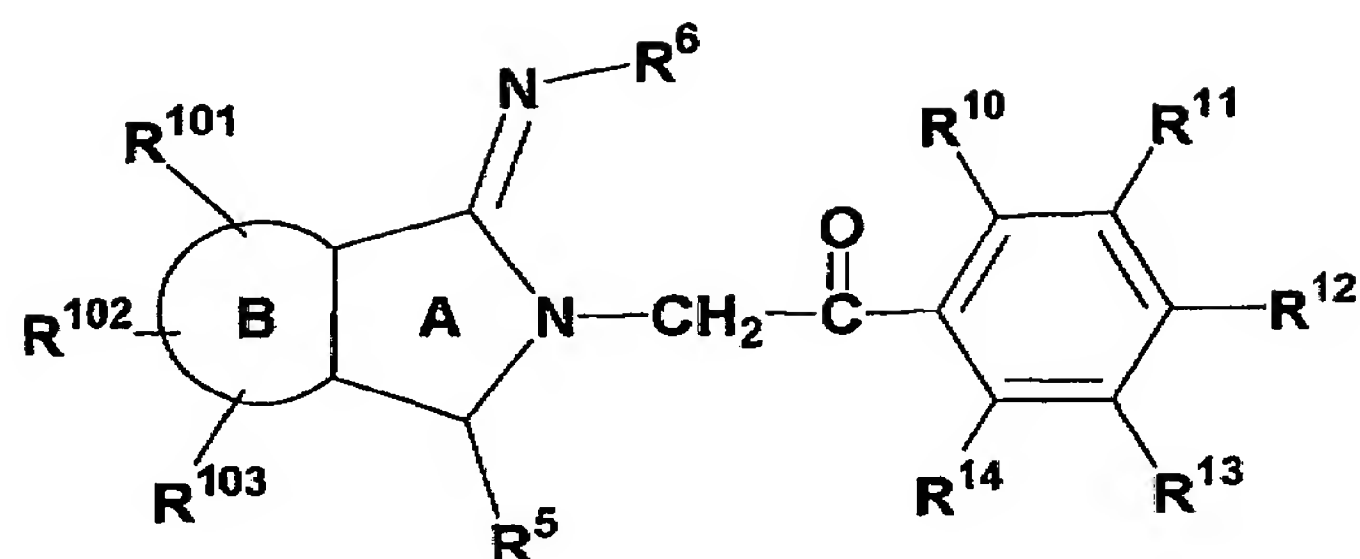
20

<前記置換基群 i' > C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、オキソ基、シアノ基、 C_{1-6} シアノアルキル基、 C_{2-7} アシル基、 C_{1-6} アルカノイル基、ベンゾイル基、アラルカノイル基、 C_{1-6} アルコキシアルキルカルボニル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキルカルボニル基、カルボキシ基、 C_{1-6} カ

- ルボキシルアルキル基、 C_{1-6} カルボキシルアルキルオキシ基、カルバモイル基、
 カルバモイルアルキルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-10} アルコ
 キシカルボニル C_{1-6} アルキル基、 C_{1-10} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル
 オキシ基、 C_{1-6} モノアルキルアミノカルボニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミノカ
 5 ルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-10} アルコキシアルキル基、 C_{1-10}
 アラルキルオキシアルキル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基、 C_{3-8} 環状アル
 キルオキシ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ
 基、アシルアミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、 C_{1-6} アルキルスルホニルア
 ミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、フェニル
 10 スルホニル基、 C_{1-6} モノアルキルアミノスルホニル基、 C_{2-6} ジアルキルアミ
 ノスルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基、 C_{3-8} 環状アルキル基、5乃
 至14員非芳香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香
 族複素環式基、含ヘテロ環状アミノカルボニル基、含ヘテロ環状アミノスルホニ
 ル基およびイソキサゾリニル基からなる群を示し、更に、前記5乃至14員非芳
 15 香族複素環式基、 C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、5乃至14員芳香族複素環式基
 およびイソキサゾリニル基は、独立に、 C_{1-6} アルキル基、オキシ基、シアノ基、
 アシル基、カルボキシ基、カルバモイル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、
 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル基、水酸基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{3-8} 環状ア
 ルキルオキシ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-6} アミノアルキル基、 C_{1-6} アルキ
 20 ルアミノ基、 C_{1-6} ジアルキルアミノ基、 C_{3-8} 環状アルキルアミノ基、アシル
 アミノ基、ウレイド基、ウレイレン基、アルキルスルホニルアミノ基、アルキル
 スルホニル基、スルファモイル基、ハロゲノ基および C_{3-8} 環状アルキル基から
 なる群から選ばれる少なくとも1の基で置換されていてもよい。]

で表わされる基である請求項1記載の化合物またはその塩。

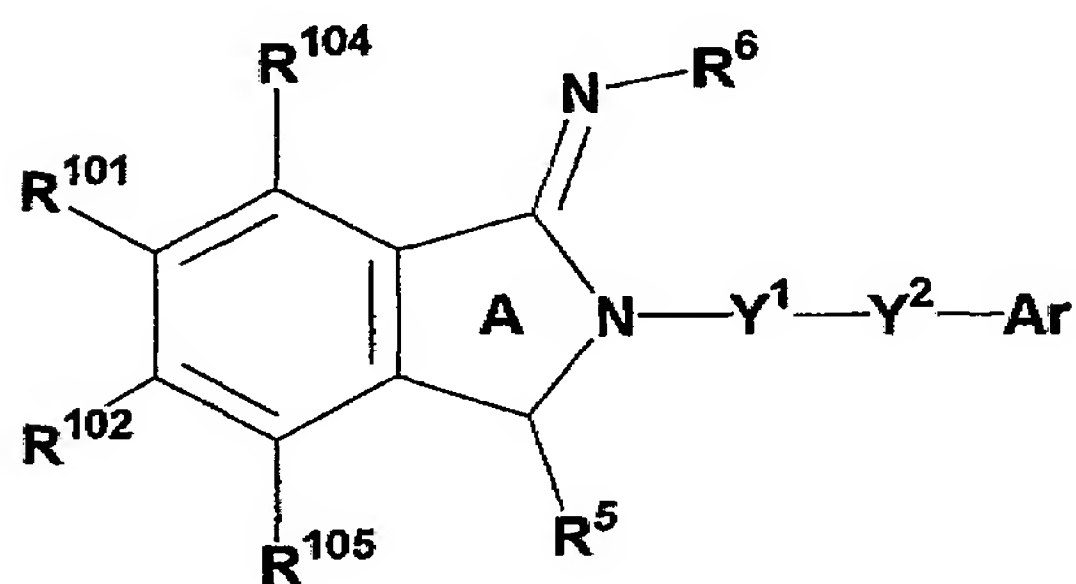
25 15. 化合物が式



[式中の記号の意義は前記定義と同意義を示す。]

で表される請求項 1 記載の化合物またはその塩。

16. 化合物が式



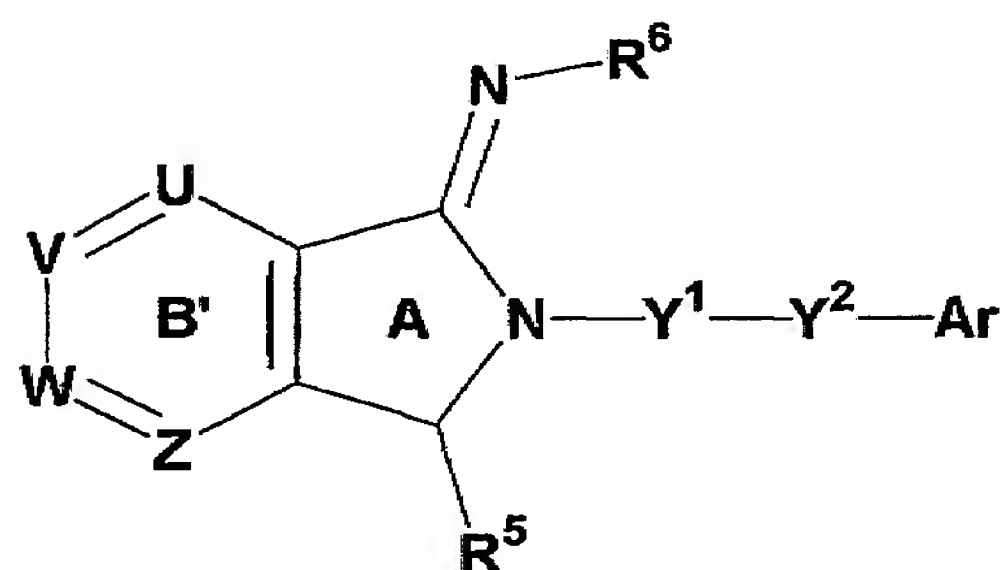
5

[式中、R¹⁰⁴およびR¹⁰⁵は同一または相異なって水素原子、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキル基またはハロゲン原子を、R¹⁰¹、R¹⁰²、R⁵、R⁶、Y¹、Y²およびArはそれぞれ前記定義と同意義を示す。]

で表される請求項 1 記載の化合物またはその塩。

10

17. 化合物が式



[式中、UはNまたはCHを示し、VはNまたはCR¹⁰¹を示し、WはNまたは

CR¹⁰²を示し、ZはNまたはCR¹⁰⁵を示し、U, V, W, Zの内1個あるいは2個がNであり；R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰⁵、R⁵、R⁶、Y¹、Y²およびArはそれぞれ前記定義と同意義を示す。]

で表される請求項1記載の化合物またはその塩。

- 5 18. Y¹は-CH₂-である請求項16または17記載の化合物またはその塩。
19. Y²は-CO-である請求項16または17記載の化合物またはその塩。
20. UがNで、VがCR¹⁰¹ [R¹⁰¹は前記定義と同意義を示す] である
- 10 請求項17記載の化合物またはその塩。
21. 請求項1記載の化合物またはその塩を含有してなる医薬組成物。
22. トロンビン受容体の拮抗剤である請求項21記載の組成物。
23. トロンビンのPAR1受容体の拮抗剤である請求項21記載の組成物。
24. 血小板凝集阻害剤である請求項21記載の組成物。
- 15 25. 平滑筋細胞の増殖阻害剤である請求項21記載の組成物。
26. 内皮細胞、繊維芽細胞、腎細胞、骨肉腫細胞、筋細胞、ガン細胞および/またはグリア細胞の増殖阻害剤である請求項21記載の組成物。
27. 血栓症、血管再狭窄、深部静脈血栓症、肺塞栓症、脳梗塞、心疾患、播種性血管内血液凝固症候群、高血圧、炎症性疾患、リウマチ、喘息、糸球体腎炎、骨粗鬆症、神経疾患および/または悪性腫瘍の治療剤または予防剤である請求項21記載の組成物。
- 20 28. トロンビン受容体拮抗剤の製造のための請求項1記載の化合物またはその塩の使用。
29. トロンビン受容体拮抗剤がPAR1受容体拮抗剤である請求項28記載の使用。
- 25 30. 血小板凝集阻害剤の製造のための請求項1記載の化合物またはその塩

の使用。

31. トロンビン受容体が関与する疾患の患者に、治療上有効量の請求項1記載の化合物またはその塩を投与する、前記疾患の治療方法。

5 32. 内皮細胞、繊維芽細胞、腎細胞、骨肉腫細胞、筋細胞、ガン細胞および／またはグリア細胞の増殖性疾患を有する患者に、治療上有効量の請求項1記載の化合物またはその塩を投与する、前記疾患の治療方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D209/44, 209/62, 401/10, 403/06, 403/10, 405/06,
413/06, 471/04, A61K31/403, 4035, 4178, 4184, 422, 437,
A61K31/454,
496, 538, 5377, A61P7/02, 9/00, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12,

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D209/44, 209/62, 401/10, 403/06, 403/10, 405/06,
413/06, 471/04, A61K31/403, 4035, 4178, 4184, 422, 437,
A61K31/454,
496, 538, 5377, A61P7/02, 9/00, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 00/67755 A1 (Merck & Co., Inc.), 16 November, 2000 (16.11.00), & US 6376530 B & EP 1178802 A1	1-4, 8-11, 16, 18, 21
X	EP 847749 A1 (L'oreal), 17 June, 1998 (17.06.98), & FR 2757053 A & CA 2222363 A & JP 10-175831 A & US 6077320 A	1-4, 16, 18
X	JP 3-50555 A (NEC Corp.), 05 March, 1991 (05.03.91), (Family: none)	1-3, 16
X	JP 62-22760 A (Sankyo Co., Ltd.), 30 January, 1987 (30.01.87), (Family: none)	1-3, 8, 10, 16

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
14 June, 2002 (14.06.02)

Date of mailing of the international search report
02 July, 2002 (02.07.02)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 53-71063 A (Grelan Pharm. Co., Ltd.), 24 June, 1978 (24.06.78), (Family: none)	1-3, 8-11, 16
X	DE 2551868 A (Gruppo Lepetit S.P.A.), 12 August, 1976 (12.08.76), & IN 141710 A & ZA 7506792 A & AU 7586204 A & FI 7503045 A & FI 7503046 A & IL 48389 A & NL 7512848 A & NO 7503853 A & NO 7503854 A & DK 7505221 A & DK 7505222 A & BE 835836 A & AT 7508845 A & SE 7513137 A & SE 7513138 A & FR 2291747 A & JP 51-75098 A & ES 442863 A & CH 614208 A & CA 1068273 A & CA 1068274 A	1-11, 15, 16, 18, 19
X	DE 2154525 A (Erba Carlo S.P.A.), 15 June, 1972 (15.06.72), & GB 1344663 A & IL 38023 A & AU 7135081 A & ES 396473 A & ZA 7107259 A & CA 978973 A & BE 774985 A & NL 7115288 A & FR 2112480 A & CH 558353 A & CH 559174 A & CH 559175 A & CH 559176 A & JP 51-68563 A & JP 52-17463 A & JP 52-31066 A & JP 52-31065 A & US 4118504 A & JP 54-117464 A	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.127, abs.No.81319	1-3, 8-11, 16
X	Z.Naturforsch., B:Chemical Sci., (1996), 51(12), p.1791-810	1-3, 7-12, 16
X	Bulletin Soc.Chim.Belg., (1992), 101(6), p.509-12	1-3, 8-11, 16
X	Khim.Geterotsikl.Soedin., (1987), (9), p.1264-9	1-3, 8-11, 16
X	Vest.Kiev.Un-ta.Khimiya, (1985), (26), p.21-5	1-3, 8-12, 16
X	Ukr.Khim.Zh., (1985), 51(6), p.644-9	1-6, 8-12, 15, 16, 18, 19
X	Arch Pharm., (1985), 318(8), p.735-43	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.103, abs.No.104932	1-4, 7-11, 16, 18
X	Ukr.Khim.Zh., (1984), 50(11), p.1198-203	1-4, 8-12, 16, 18
X	Chemical Abstracts, Vol.102, abs.No.220805	1-3, 16

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Ukr.Khim.Zh., (1984), 50(10), p.1105-10	1-6, 8-13, 15, 16, 18, 19
X	Ukr.Khim.Zh., (1984), 50(5), p.530-4	1-4, 8-12, 16, 18
X	Ukr.Khim.Zh., (1981), 47(7), p.735-8	1-3, 5, 8-13, 16, 19
X	Ukr.Khim.Zh., (1981), 47(3), p.291-5	1-3, 5, 8-11, 16, 19
X	J.Heterocycl.Chem., (1978), 15(3), p.369-75	1-3, 8-11, 16
X	Arch.Pharm., (1976), 309(5), p.356-66	1-3, 8-11, 16
X	Z.Naturforsch., Teil B, (1973), 28(11-12), p.801-4	1-3, 7, 16
X	Arzneim.-Forsch., (1973), 23(8), p.1090-100	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.76, abs.No.153482	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.72, abs.No.132428	1-3, 8-12, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.53, abs.No.16106c-16107d	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, Vol.53, abs.No.15082h-15085d	1-3, 8-11, 16
A	WO 98/37075 A1 (Boehringer Ingelheim Pharma KG), 27 August, 1998 (27.08.98), & AU 9863991 A & DE 19751939 A & DE 19706229 A & ZA 9801275 A & NO 9903945 A & EP 966454 A1 & CN 1248251 A & SK 9901121 A & CZ 9902915 A & US 6087380 A & NZ 337323 A & BR 9807843 A & KR 2000071066 A & HU 200001116 A & JP 2001-509815 A	1-30
A	WO 99/40072 A1 (Boehringer Ingelheim Pharma KG), 12 August, 1999 (12.08.99), & AU 9927201 A & DE 19804085 A & DE 19834325 A & US 6114532 A & EP 1060166 A1 & JP 2002-502844 A	1-30

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 31, 32

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

Claims 31 and 32 pertain to methods for treatment of the human body by therapy.

2. ☐ Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03961

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 19/10, 25/00, 29/00, 35/00, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum Documentation Searched(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 19/10, 25/00, 29/00, 35/00, 43/00

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JPO2/03961

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D209/44, 209/62, 401/10, 403/06, 403/10, 405/06, 413/06, 471/04, A61K31/403, 4035, 4178, 4184, 422, 437, A61K31/454, 496, 538, 5377, A61P7/02, 9/00, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12, 19/10, 25/00, 29/00, 35/00, 43/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D209/44, 209/62, 401/10, 403/06, 403/10, 405/06, 413/06, 471/04, A61K31/403, 4035, 4178, 4184, 422, 437, A61K31/454, 496, 538, 5377, A61P7/02, 9/00, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12, 19/10, 25/00, 29/00, 35/00, 43/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO 00/67755 A1 (MERCK & CO., INC.) 2000.11.16 & US 6376530 B & EP 1178802 A1	1-4, 8-11, 16, 18, 21
X	EP 847749 A1 (L' OREAL) 1998.06.17 & FR 2757053 A & CA 2222363 A & JP 10-175831 A & US 6077320 A	1-4, 16, 18
X	JP 3-50555 A (NEC CORP.) 1991.03.05 (ファミリーなし)	1-3, 16
X	JP 62-22760 A (SANKYO CO., LTD.) 1987.01.30 (ファミリーなし)	1-3, 8, 10, 16

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に関する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

14.06.02

国際調査報告の発送日

02.07.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JPO)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

富永 保

4P

9159

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JPO2/03961

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	JP 53-71063 A (GRELAN PHARM. CO., LTD.) 1978. 06. 24 (ファミリーなし)	1-3, 8-11, 16
X	DE 2551868 A (GRUPPO LEPETIT S. P. A.) 1976. 08. 12 & IN 141710 A & ZA 7506792 A & AU 7586204 A & FI 7503045 A & FI 7503046 A & IL 48389 A & NL 7512848 A & NO 7503853 A & NO 7503854 A & DK 7505221 A & DK 7505222 A & BE 835836 A & AT 7508845 A & SE 7513137 A & SE 7513138 A & FR 2291747 A & JP 51-75098 A & ES 442863 A & CH 614208 A & CA 1068273 A & CA 1068274 A	1-11, 15, 16, 18, 19
X	DE 2154525 A (ERBA CARLO S. P. A.) 1972. 06. 15 & GB 1344663 A & IL 38023 A & AU 7135081 A & ES 396473 A & ZA 7107259 A & CA 978973 A & BE 774985 A & NL 7115288 A & FR 2112480 A & CH 558353 A & CH 559174 A & CH 559175 A & CH 559176 A & JP 51-68563 A & JP 52-17463 A & JP 52-31066 A & JP 52-31065 A & US 4118504 A & JP 54-117464 A	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 127, abs. no. 81319	1-3, 8-11, 16
X	Z. Naturforsch., B: Chemical Sci., (1996), 51(12), p. 1791-810	1-3, 7-12, 16
X	Bulletin Soc. Chim. Belg., (1992), 101(6), p. 509-12	1-3, 8-11, 16
X	Khim. Geterotsikl. Soedin., (1987), (9), p. 1264-9	1-3, 8-11, 16
X	Vest. Kiev. Un-ta. Khimiya, (1985), (26), p. 21-5	1-3, 8-12, 16
X	Ukr. Khim. Zh., (1985), 51(6), p. 644-9	1-6, 8-12, 15, 16, 18, 19,
X	Arch Pharm., (1985), 318(8), p. 735-43	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 103, abs. no. 104932	1-4, 7-11, 16, 18
X	Ukr. Khim. Zh., (1984), 50(11), p. 1198-203	1-4, 8-12, 16, 18
X	Chemical Abstracts, vol. 102, abs. no. 220805	1-3, 16
X	Ukr. Khim. Zh., (1984), 50(10), p. 1105-10	1-6, 8-13, 15, 16, 18, 19

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP02/03961

C (続き) 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	Ukr. Khim. Zh., (1984), 50 (5), p. 530-4	1-4, 8-12, 16, 18
X	Ukr. Khim. Zh., (1981), 47 (7), p. 735-8	1-3, 5, 8-13, 16, 19
X	Ukr. Khim. Zh., (1981), 47 (3), p. 291-5	1-3, 5, 8-11, 16, 19
X	J. Heterocycl. Chem., (1978), 15 (3), p. 369-75	1-3, 8-11, 16
X	Arch. Pharm., (1976), 309 (5), p. 356-66	1-3, 8-11, 16
X	Z. Naturforsch., Teil B, (1973), 28 (11-12), p. 801-4	1-3, 7, 16
X	Arzneim.-Forsch., (1973), 23 (8), p. 1090-100	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 76, abs. no. 153482	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 72, abs. no. 132428	1-3, 8-12, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 53, abs. no. 16106c-16107d	1-3, 8-11, 16
X	Chemical Abstracts, vol. 53, abs. no. 15082h-15085d	1-3, 8-11, 16
A	WO 98/37075 A1 (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA KG) 1998.08.27 & AU 9863991 A & DE 19751939 A & DE 19706229 A & ZA 9801275 A & NO 9903945 A & EP 966454 A1 & CN 1248251 A & SK 9901121 A & CZ 9902915 A & US 6087380 A & NZ 337323 A & BR 9807843 A & KR 2000071066 A & HU 200001116 A & JP 2001-509815 A	1-30
A	WO 99/40072 A1 (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA KG) 1999.08.12 & AU 9927201 A & DE 19804085 A & DE 19834325 A & US 6114532 A & EP 1060166 A1 & JP 2002-502844 A	1-30

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP02/03961

第I欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 31, 32 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、請求の範囲31, 32に記載された発明は、人体の治療による処置方法に該当する。
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第II欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。